

(51) Int.Cl.<sup>7</sup>

識別記号

F I

テマコード(参考)

C 0 7 H 17/08  
A 6 1 K 31/7048  
A 6 1 P 1/04  
31/04

C 0 7 H 17/08  
A 6 1 K 31/7048  
A 6 1 P 1/04  
31/04

B 4 C 0 5 7  
4 C 0 8 6

審査請求 未請求 請求項の数 4 O L (全 74 頁)

(21) 出願番号 特願平11-368653

(22) 出願日 平成11年12月27日 (1999. 12. 27)

(71) 出願人 000242622

北陸製薬株式会社

福井県勝山市猪野口37号1番地1

(72) 発明者 加藤 日出男

福井県勝山市猪野口37号1番地1 北陸製  
薬株式会社内

(72) 発明者 加戸 典幸

福井県勝山市猪野口37号1番地1 北陸製  
薬株式会社内

(72) 発明者 吉田 敏彦

福井県勝山市猪野口37号1番地1 北陸製  
薬株式会社内

最終頁に続く

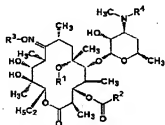
(54) 【発明の名称】 エリスロマイシン誘導体

(57) 【要約】

【課題】 抗菌剤又は抗潰瘍剤として有用な化合物を提供する。

【解決手段】 次の一般式

【化1】



(式中、R<sup>1</sup>は水素原子又は低級アルキル基を表し、R<sup>2</sup>及びR<sup>3</sup>は各々独立して置換基を有してもよいアルキル基、置換基を有してもよいアルケニル基、置換基を有してもよいアルキニル基、置換基を有してもよい同素もしくは複素環基、置換基を有してもよい同素もしくは複素環置換アルキル基を表し、R<sup>4</sup>は置換基を有するメチル基、置換基を有してもよい炭素数2以上のアルキル基、置換基を有してもよいアルケニル基、置換基を有しても

よいアルキニル基、置換基を有してもよい同素もしくは複素環基、置換基を有してもよい同素もしくは複素環置換アルキル基を表す。)で示されるエリスロマイシン誘導体又はその塩は、多剤耐性菌を含むヘリコバクター・ピロリに対して優れた抗菌力を有し、抗菌剤又は抗潰瘍剤として極めて有用である。

BEST AVAILABLE COPY



基、置換基を有してもよいアルケニル基、置換基を有してもよいアルキニル基、置換基を有してもよい同素もしくは複素環基又は置換基を有してもよい同素もしくは複素環置換アルキル基を表し、R<sup>4</sup>は置換基を有するメチル基、置換基を有してもよい炭素数2以上のアルキル基、置換基を有してもよいアルケニル基、置換基を有してもよいアルキニル基、置換基を有してもよい同素もしくは複素環基又は置換基を有してもよい同素もしくは複素環置換アルキル基を表す。)で示される新規なエリスロマイシン誘導体又はその塩に関するものである。

【0006】本発明の別の態様によれば、前記一般式(I)で示される化合物又はその塩を有効成分とする医薬が提供される。本発明により提供される医薬は、例えば、抗菌剤又は抗潰瘍剤として好適に用いることができる。

【0007】本発明の実施の形態】本発明の前記一般式(I)において、R<sup>1</sup>で示される低級アルキル基としては、例えば、メチル基、エチル基、n-プロピル基、n-ブチル基等が挙げられる。又、R<sup>2</sup>又はR<sup>3</sup>で示される置換基を有してもよいアルキル基のアルキル基は、炭素数1〜12個の直鎖状又は分枝鎖状のアルキル基を有してもよい炭素数2以上のアルキル基のアルキル基は、炭素数2〜12個の直鎖状又は分枝鎖状のアルキル基を表し、例えば、メチル基、エチル基、n-プロピル基、イソプロピル基、n-ブチル基、イソブチル基、sec-ブチル基、tert-ブチル基、n-ペンチル基、イソペンチル基、ネオペンチル基、tert-ペンチル基、1-メチルブチル基、2-メチルブチル基、1-エチルプロピル基、n-ヘキシル基、1-メチルペンチル基、2-メチルペンチル基、3-メチルペンチル基、4-メチルペンチル基、2,3-ジメチルブチル基、1,3-ジメチルブチル基、1,2-ジメチルブチル基、1-エチルブチル基、2-エチルブチル基、1-(1'-メチル)エチルプロピル基、n-ヘプチル基、n-オクタニル基、n-ニル基、n-デシル基、n-ウンデシル基、n-ドデシル基等が挙げられる。

【0008】本発明の前記一般式(I)において、R<sup>2</sup>、R<sup>3</sup>又はR<sup>4</sup>で示される置換基を有してもよいアルケニル基のアルケニル基としては、炭素数2〜12個の直鎖状又は分枝鎖状の任意の位置に1個以上の二重結合を有するアルケニル基又はアルカボリエニル基を表し、例えば、ビニル基、アリル基、1-メチルビニル基、プロペニル基、ブテニル基、ブタジエニル基、ペンテニル基、イソペンテニル基、4-メチルペンテニル基、ヘキセニル基、ヘキサジエニル基、ヘキサトリエニル基、ヘプテニル基、オクテニル基、ノネニル基、デセニル基、ウンデセニル基、ドデセニル基、テトラニル基、ミルセニル基、オシメニル基、ネリル基、リナイル基、シトロネリル基等が挙げられる。R<sup>2</sup>、R<sup>3</sup>又はR<sup>4</sup>で示される置

換基を有してもよいアルケニル基のアルキニル基としては、炭素数2〜12個の直鎖状又は分枝鎖状の任意の位置に1個以上の三重結合を有するアルキニル基又はアルカボリエニル基を表し、例えば、エチニル基、プロピニル基、ブチニル基、ペンチニル基、ヘキシニル基、ヘキサジニル基、ヘプタニル基、オクタニル基、ノニル基、デシニル基、ウンデシニル基、ドデシニル基等が挙げられる。

【0009】R<sup>2</sup>、R<sup>3</sup>又はR<sup>4</sup>で示される置換基を有してもよい同素もしくは複素環基の同素もしくは複素環基は、単環又は多環で飽和又は不飽和の同素もしくは複素環基を表し、例えば、シクロプロピル基、シクロブチル基、シクロペンチル基、シクロヘキシル基、シクロ[3.2.1]オクタニル基、シクロ[5.2.0]ノニル基、アジリジニル基、アゼチジニル基、ピロリジニル基、ビペリジニル基、ヘキサヒドロ-1H-アゼビニル基、ビペラジニル基、モルホリニル基、チオモルホリニル基、テトラヒドロピラニル基、テトラヒドロチオピラニル基、フェニル基、ナフチル基、ビリジニル基、ピリミジニル基、ピラジニル基、イミダゾリニル基、オキサゾリニル基、イソオキサゾリニル基、チアゾリニル基、イソチアゾリニル基、フリル基、チエニル基、ピロリル基、ベンゾフリラニル基、ベンゾ[*b*]チエニル基、ベンゾイミダゾリニル基、インドリル基、キノリル基、イソキノリル基、

1,2,3,4-テトラヒドロナフチル基等が挙げられる。R<sup>2</sup>、R<sup>3</sup>又はR<sup>4</sup>で示される置換基を有してもよい同素もしくは複素環置換アルキル基の同素もしくは複素環置換アルキル基は、炭素数1〜12個の直鎖状又は分枝鎖状のアルキル基に、単環又は多環で飽和又は不飽和の同素もしくは複素環基が任意の位置で置換した基を表し、例えば、シクロプロピルメチル基、シクロブチルメチル基、シクロペンチルメチル基、シクロヘキシルメチル基、シクロプロピルエチル基、シクロブチルエチル基、シクロペンチルエチル基、シクロヘキシルエチル基、シクロヘキシルプロピル基、シクロヘキシルブチル基、シクロヘキシルペンチル基、シクロヘキシルヘキシル基、シクロヘキシルヘプチル基、シクロヘキシルオクタニル基、シクロヘキシルノニル基、シクロヘキシルデシル基、シクロヘキシルウンデシル基、シクロヘキシルドデシル基、アジリジニルエチル基、アゼチジニルエチル基、ピロリジニルエチル基、ビペリジニルエチル基、ヘキサヒドロ-1H-アゼビニルエチル基、ビペラジニルエチル基、モルホリニルエチル基、チオモルホリニルエチル基、ビペリジニルプロピル基、ビペリジニルブチル基、ビペリジニルペンチル基、ビペリジニルヘキシル基、ビペリジニルヘプチル基、ビペリジニルオクタニル基、ビペリジニルノニル基、ビペリジニルデシル基、ビペリジニルウンデシル基、ビペリジニルドデシル基、テトラヒドロピラニルメチル基、テトラヒドロチオピラニルメチル基、ベンジル基、フェニル基、 $\alpha$ -メチルフ

エネチル基、フェニルプロピル基、フェニルブチル基、フェニルペンチル基、フェニルヘキシル基、フェニルヘプチル基、フェニルオクタシル基、フェニルノニル基、フェニルデシル基、フェニルウンデシル基、フェニルドデシル基、ナフチルメチル基、ビリジルメチル基、ビリジルエチル基、ビリジルプロピル基、ビリジルメチル基、ヒラジニルメチル基、イミタゾリルメチル基、オキサゾリルメチル基、イソオキサゾリルメチル基、チアゾリルメチル基、イソチアゾリルメチル基、フリルメチル基、フリルエチル基、テニル基、チエニルエチル基、ヒロリルメチル基、ヒロリルエチル基、ヒロリルプロピル基、ベンゾフリルメチル基、ベンゾフリルエチル基、ベンゾ[b]チエニルメチル基、ベンゾ[b]チエニルエチル基、ベンゾイミダゾリルメチル基、インドリルメチル基、インドリルエチル基、インドリルプロピル基、キノリルメチル基、キノリルエチル基、イソキノリルメチル基、イソキノリルエチル基、1, 2, 3, 4-テトラヒドロナフチルエチル基、2, 3-ジヒドロベンゾフリルメチル基、2, 3-ジヒドロベンゾフリルエチル基、クロマン-2-イルメチル基、2, 3-ジヒドロベンゾジオキシニルメチル基等が挙げられる。

【0010】尚、本明細書において、「同素もしくは複素環」の置換結合部位としては、環構成成分中、置換結合可能な元素であればいかなる位置でもよい基を含む事態として用いる。

【0011】本発明の前記一般式(1)において、ある官能基について「置換基を有してもよい」という場合には、これらの基に置換可能な基ならばいかなるものでもよい。置換基の個数及び種類は特に限定されず、2個以上の置換基が存在する場合には、それらは同一でも異なってもよい。例えば、保護基を有してもよい水酸基、アルコキシ基、アルキルチオ基、置換基を有してもよいアミノ基、置換基を有してもよいカルバモイル基、アリールオキシ基、アリールチオ基、アラルキオキシ基、アラルキルチオ基、ハロゲン原子、アルキル基、トリフルオロメチル基、アシル基、シクロアルキル基、アリール基、アラルキル基、シアノ基、ニトロ基、グアニジノ基、アミジノ基、カルボキシル基、アルコキシカルボニル基、アリールオキシカルボニル基、アラルキルオキシカルボニル基、アルキルスルフィニル基、アリアルスルホニル基、アリアルスルホニル基、アラルキルスルホニル基等が挙げられる。

【0012】水酸基の保護基としては、水酸基が反応に関与すべきでない系において実質的に不活性であって、且つ特定の脱保護反応の条件下で容易に開裂できるものならばいかなるものを用いてもよく、例えば、アルカノイル基、トリアルキルシリル基、ベンジル基等が挙げられる。水酸基の保護基であるアルカノイル基としては、例えば、ホルミル基、アセチル基、プロピオニル基、ブ

チリル基、ヒパロイル基等が、水酸基の保護基であるトリアルキルシリル基としては、例えば、トリメチルシリル基、トリエチルシリル基等が挙げられる。アルコキシ基は直鎖状又は分枝鎖状のアルコキシ基を表し、例えば、メトキシ基、エトキシ基、n-プロポキシ基、n-ブトキシ基、n-ペンチルオキシ基、n-ヘキシルオキシ基、n-ヘプチルオキシ基、n-オクタシルオキシ基、n-ノニルオキシ基、n-デシルオキシ基、n-ウンデシルオキシ基、n-ドデシルオキシ基等が挙げられる。アルキルチオ基は直鎖状又は分枝鎖状のアルキルチオ基を表し、例えば、メチルチオ基、エチルチオ基、n-プロピルチオ基、n-ブチルチオ基、n-ペンチルチオ基、n-ヘキシルチオ基、n-ヘプチルチオ基、n-オクタシルチオ基、n-ノニルチオ基、n-デシルチオ基、n-ウンデシルチオ基、n-ドデシルチオ基等が挙げられる。

【0013】置換基を有してもよいアミノ基としては、例えば、アミノ基、メチルアミノ基、エチルアミノ基、n-プロピルアミノ基、n-ブチルアミノ基、n-ペンチルアミノ基、n-ヘキシルアミノ基、n-ヘプチルアミノ基、n-オクタシルアミノ基、n-ノニルアミノ基、n-デシルアミノ基、n-ウンデシルアミノ基、n-ドデシルアミノ基等が挙げられる。置換基を有してもよいカルバモイル基としては、例えば、カルバモイル基、N-メチルカルバモイル基、N-エチルカルバモイル基、N-n-プロピルカルバモイル基、N-i-プロピルカルバモイル基、N-n-ブチルカルバモイル基、N-i-ブチルカルバモイル基、N-sec-ブチルカルバモイル基、N-tert-ブチルカルバモイル基、N-n-ペンチルカルバモイル基、N-i-ペンチルカルバモイル基、N-tert-ペンチルカルバモイル基、N-n-ヘキシルカルバモイル基、N-n-ベンジルカルバモイル基、N-n-ジメチルカルバモイル基、N-n-ジエチルカルバモイル基、N-n-ジベンジルカルバモイル基、N-n-エチル-N-メチルカルバモイル基等が挙げられる。

【0014】アリールオキシ基としては、例えば、フェノキシ基、メチルフェノキシ基、ニトロフェノキシ基、ビリジリオキシ基、ビリジルオキシ基、ヒラジニルオキシ基、イミダゾリルオキシ基、オキサゾリルオキシ基、イソオキサゾリルオキシ基、チアゾリルオキシ基、イソチアゾリルオキシ基、ナフチルオキシ基、フリルオ

キシ基、ベンゾフラニルオキシ基、ベンゾ〔b〕チエニルオキシ基、ベンゾイミダゾリルオキシ基、インドリルオキシ基、チエニルオキシ基、ピロリルオキシ基、キノリルオキシ基、イソキノリルオキシ基、(1, 2, 3, 4-テトラヒドロナフタレン-5-イル)オキシ基、(1, 2, 3, 4-テトラヒドロナフタレン-6-イル)オキシ基等が挙げられ、アリールオキシ基としては、例えば、フェニルオキシ基、ビリジニルオキシ基、ピリミジニルオキシ基、ピラジニルオキシ基、イミダゾリルオキシ基、オキサゾリルオキシ基、イソオキサゾリルオキシ基、チアゾリルオキシ基、イソチアゾリルオキシ基、ナフチルオキシ基、フリルオキシ基、ベンゾフラニルオキシ基、ベンゾ〔b〕チエニルオキシ基、ベンゾイミダゾリルオキシ基、インドリルオキシ基、チエニルオキシ基、キノリルオキシ基、イソキノリルオキシ基、(1, 2, 3, 4-テトラヒドロナフタレン-5-イル)オキシ基、(1, 2, 3, 4-テトラヒドロナフタレン-6-イル)オキシ基等が挙げられる。アラルキルオキシ基としては、例えば、ベンジルオキシ基、フェネチルオキシ基、フェニルプロピルオキシ基、フェニルヘキシルオキシ基、フェニルデシルオキシ基等が挙げられ、例えば、ベンジルオキシ基、フェネチルオキシ基、フェニルプロピルオキシ基、フェニルヘキシルオキシ基、フェニルデシルオキシ基、イソフェニルオキシ基、フェニルデシルオキシ基等が挙げられ、ハロゲン原子としては、例えば、フッ素原子、塩素原子、臭素原子、ヨウ素原子が挙げられる。

【0015】アシル基としては、例えば、ホルミル基、アセチル基、プロピオニル基、ブチル基、ヒバロイル基、ペンタイル基、ニコチノイル基、イソニコチノイル基、ビリジニルカルボニル基、ピラジニルカルボニル基、オキサゾリルカルボニル基、イソオキサゾリルカルボニル基、チアゾリルカルボニル基、イソチアゾリルカルボニル基、ナフトイル基、フロイル基、ベンゾフラニルカルボニル基、ベンゾ〔b〕チエニルカルボニル基、ベンゾイミダゾリルカルボニル基、インドリルカルボニル基、テノイル基、ピロリルカルボニル基、キノリルカルボニル基、イソキノリルカルボニル基、(1, 2, 3, 4-テトラヒドロナフタレン-5-イル)カルボニル基、(1, 2, 3, 4-テトラヒドロナフタレン-6-イル)カルボニル基、フェニルアセチル基、ビリジニルアセチル基、ピラジニルアセチル基、イミダゾリルアセチル基、オキサゾリルアセチル基、イソオキサゾリルアセチル基、チアゾリルアセチル基、イソチアゾリルアセチル基、ナフチルアセチル基、フリルアセチル基、ベンゾフラニルアセチル基、ベンゾ〔b〕チエニルアセチル基、ベンゾイミダゾリルアセチル基、インドリルアセチル基、チエニルアセチル基、キノリルアセチル基、イソキノリルアセチル基、(1, 2, 3, 4-テトラヒドロナフタレン-5-イル)アセチル基、(1, 2, 3, 4-テトラ

ヒドロナフタレン-6-イル)アセチル基、フェニルプロピオニル基、フェニルヘキシルカルボニル基、フェニルデシルカルボニル基、シクロヘキシルアセチル基等が挙げられる。

【0016】シクロアルキル基としては、例えば、シクロプロピル基、シクロブチル基、シクロペンチル基、シクロヘキシル基等が挙げられ、アリール基としては、例えば、フェニル基、ナフチル基、ビリジニル基、ピリミジニル基、ピラジニル基、イミダゾリル基、オキサゾリル基、イソオキサゾリル基、チアゾリル基、イソチアゾリル基、フリル基、チエニル基、ピロリル基、ベンゾフラニル基、ベンゾ〔b〕チエニル基、ベンゾイミダゾリル基、インドリル基、キノリル基、イソキノリル基、1, 2, 3, 4-テトラヒドロナフチル基等が挙げられる。アラルキル基としては、例えば、ベンジル基、フェネチル基、フェニルプロピル基、フェニルブチル基、フェニルペンチル基、フェニルヘキシル基、フェニルヘプタシル基、フェニルオクタシル基、フェニルニル基、フェニルデシル基、フェニルウンデシル基、フェニルドデシル基、ナフチルメチル基、ビリジニルメチル基、ピリジニルプロピル基、ビリジニルプロピル基、イミダゾリルプロピル基、オキサゾリルプロピル基、イソオキサゾリルプロピル基、チアゾリルプロピル基、イソチアゾリルプロピル基、フリルプロピル基、チエニルプロピル基、ピロリルプロピル基、ベンゾフラニルプロピル基、ベンゾ〔b〕チエニルプロピル基、ベンゾイミダゾリルプロピル基、インドリルプロピル基、キノリルプロピル基、イソキノリルプロピル基等が挙げられる。

【0017】アルコキシカルボニル基としては、例えば、メトキシカルボニル基、エトキシカルボニル基、n-プロポキシカルボニル基、イソプロポキシカルボニル基、n-ブトキシカルボニル基、イソブトキシカルボニル基、sec-ブトキシカルボニル基、tert-ブトキシカルボニル基、n-ペンチルオキシカルボニル基、イソペンチルオキシカルボニル基、ネオペンチルオキシカルボニル基、tert-ペンチルオキシカルボニル基、n-ヘキシルオキシカルボニル基、n-ヘプタシルオキシカルボニル基、n-オクタシルオキシカルボニル基、n-ノニルオキシカルボニル基、n-デシルオキシカルボニル基、n-ウンデシルオキシカルボニル基、n-ドデシルオキシカルボニル基等が挙げられ、アリールオキシカルボニル基としては、例えば、フェノキシカルボニル基、ビリジニルオキシカルボニル基、ピラジニルオキシカルボニル基、イミダゾリルオキシカルボニル基、オキサゾリルオキシカルボニル基、イソオキサゾリルオキシカルボニル基、チアゾリルオキシカルボニル基、イソチアゾリルオキシカルボニル基、ナフチルオキシカルボニル基、フリルオキシカルボニル基、ベンゾフラニルオキシカルボニル基、ベンゾ〔b〕チエニルオキシカルボニル

ニル基、ベンゾイミダゾリルオキシカルボニル基、インドリルオキシカルボニル基、チエニルオキシカルボニル基、ピロリルオキシカルボニル基、キノリルオキシカルボニル基、イソキノリルオキシカルボニル基、(1, 2, 3, 4-テトラヒドロナフタレン-5-イル)オキシカルボニル基、(1, 2, 3, 4-テトラヒドロナフタレン-6-イル)オキシカルボニル基等が挙げられ、アラルキルオキシカルボニル基としては、例えば、ベンジルオキシカルボニル基、ビリジルメチルオキシカルボニル基、ビリジルメチルオキシカルボニル基、ピラジニルメチルオキシカルボニル基、イミダゾリルメチルオキシカルボニル基、オキサゾリルメチルオキシカルボニル基、チアゾリルメチルオキシカルボニル基、イソチアゾリルメチルオキシカルボニル基、ナフチルメチルオキシカルボニル基、フルルメチルオキシカルボニル基、ベンゾフラニルメチルオキシカルボニル基、ベンゾ[b]チエニルメチルオキシカルボニル基、ベンゾイミダゾリルメチルオキシカルボニル基、インドリルメチルオキシカルボニル基、チエニルメチルオキシカルボニル基、ピロリルメチルオキシカルボニル基、キノリルメチルオキシカルボニル基、イソキノリルメチルオキシカルボニル基、(1, 2, 3, 4-テトラヒドロナフタレン-5-イル)メチルオキシカルボニル基、(1, 2, 3, 4-テトラヒドロナフタレン-6-イル)メチルオキシカルボニル基、フェネチルオキシカルボニル基、フェニルヘキシルオキシカルボニル基、フェニルデシルオキシカルボニル基等が挙げられる。

【0018】アルキルスルフィニル基としては、例えば、メチルスルフィニル基、エチルスルフィニル基、n-プロピルスルフィニル基、イソプロピルスルフィニル基、n-ブチルスルフィニル基、イソブチルスルフィニル基、sec-ブチルスルフィニル基、tert-ブチルスルフィニル基、n-ペンチルスルフィニル基、イソペンチルスルフィニル基、ネオペンチルスルフィニル基、tert-ペンチルスルフィニル基、n-ヘキシルスルフィニル基、n-ヘプタシルスルフィニル基、n-オクタシルスルフィニル基、n-ノニルスルフィニル基、n-デシルスルフィニル基、n-ウンデシルスルフィニル基、n-ドデシルスルフィニル基等が挙げられ、アリールスルフィニル基としては、例えば、フェニルスルフィニル基、ビリジルスルフィニル基、ビリジルスルフィニル基、ピラジニルスルフィニル基、イミダゾリルスルフィニル基、オキサゾリルスルフィニル基、イソキサゾリルスルフィニル基、チアゾリルスルフィニル基、フルリスルフィニル基、ベンゾフランリスルフィニル基、ベンゾ[b]チエニルスルフィニル基、ベンゾイミダゾリルスルフィニル基、インドリルスルフィニル基、チエニルスルフィニル基、ピロリルスルフィニル基、キノリルスルフィニル基、イソキノ

リルスルフィニル基、(1, 2, 3, 4-テトラヒドロナフタレン-5-イル)スルフィニル基、(1, 2, 3, 4-テトラヒドロナフタレン-6-イル)スルフィニル基等が挙げられ、アラルキルスルフィニル基としては、例えば、ベンジルスルフィニル基、ビリジルメチルスルフィニル基、ビリジルメチルスルフィニル基、ピラジニルメチルスルフィニル基、イミダゾリルメチルスルフィニル基、オキサゾリルメチルスルフィニル基、イソキサゾリルメチルスルフィニル基、ナフチルメチルスルフィニル基、フルリスルフィニル基、ベンゾフランリスルフィニル基、ベンゾ[b]チエニルメチルスルフィニル基、ベンゾイミダゾリルメチルスルフィニル基、インドリルメチルスルフィニル基、チエニルメチルスルフィニル基、ピロリルメチルスルフィニル基、キノリルメチルスルフィニル基、イソキノリルメチルスルフィニル基、(1, 2, 3, 4-テトラヒドロナフタレン-5-イル)メチルスルフィニル基、(1, 2, 3, 4-テトラヒドロナフタレン-6-イル)メチルスルフィニル基、フェネチルスルフィニル基、フェニルヘキシルスルフィニル基、フェニルデシルスルフィニル基等が挙げられる。

【0019】アルキルスルホニル基としては、例えば、メシル基、エチルスルホニル基、n-プロピルスルホニル基、イソプロピルスルホニル基、n-ブチルスルホニル基、イソブチルスルホニル基、sec-ブチルスルホニル基、tert-ブチルスルホニル基、n-ペンチルスルホニル基、イソペンチルスルホニル基、ネオペンチルスルホニル基、tert-ペンチルスルホニル基、n-ヘキシルスルホニル基、n-ヘプタシルスルホニル基、n-オクタシルスルホニル基、n-ノニルスルホニル基、n-デシルスルホニル基、n-ウンデシルスルホニル基、n-ドデシルスルホニル基等が挙げられ、アリールスルホニル基としては、例えば、フェニルスルホニル基、トリルスルホニル基、ビリジルスルホニル基、ビリジルスルホニル基、ピラジニルスルホニル基、イミダゾリルスルホニル基、オキサゾリルスルホニル基、イソキサゾリルスルホニル基、チアゾリルスルホニル基、フルリスルホニル基、ベンゾフランリスルホニル基、ベンゾ[b]チエニルスルホニル基、ベンゾイミダゾリルスルホニル基、インドリルスルホニル基、チエニルスルホニル基、ピロリルスルホニル基、キノリルスルホニル基、イソキノリルスルホニル基、(1, 2, 3, 4-テトラヒドロナフタレン-5-イル)スルホニル基、(1, 2, 3, 4-テトラヒドロナフタレン-6-イル)スルホニル基等が挙げられ、アラルキルスルホニル基としては、例えば、ベンジルスルホニル基、ビリジルメチルスルホニル基、ピラジニルメチルスルホニル基、イミダゾリルメチルスルホニル基、オキサゾリルメチルスルホニル基、イソキサゾリルメチルスルホニル基、ナフチルメチルスルホニル基、フルリスルホニル基、ベンゾフランリスルホニル基、ベンゾ[b]チエニルメチルスルホニル基、ベンゾイミダゾリルメチルスルホニル基、インドリルメチルスルホニル基、チエニルメチルスルホニル基、ピロリルメチルスルホニル基、キノリルメチルスルホニル基、イソキノリルメチルスルホニル基、(1, 2, 3, 4-テトラヒドロナフタレン-5-イル)メチルスルホニル基、(1, 2, 3, 4-テトラヒドロナフタレン-6-イル)メチルスルホニル基、フェネチルスルホニル基、フェニルヘキシルスルホニル基、フェニルデシルスルホニル基等が挙げられる。

チルスルホニル基、チアゾリルメチルスルホニル基、イソチアゾリルメチルスルホニル基、ナフチルメチルスルホニル基、フリルメチルスルホニル基、ベンゾフラニルメチルスルホニル基、ベンゾ[b]チエニルメチルスルホニル基、ベンゾイミダゾリルメチルスルホニル基、インドリルメチルスルホニル基、チエニルメチルスルホニル基、ピロリルメチルスルホニル基、キノリルメチルスルホニル基、イソキノリルメチルスルホニル基、(1, 2, 3, 4-テトラヒドロナフタレン-5-イル)メチルスルホニル基、(1, 2, 3, 4-テトラヒドロナフタレン-6-イル)メチルスルホニル基、フェネチルスルホニル基、フェニルヘキシルスルホニル基、フェニルデシルスルホニル基等が挙げられる。又、上記の置換可能なアルキル基としては、例えば、前述に例記したような基が挙げられる。

【0020】R<sup>4</sup>で示される置換基を有するメチル基の置換基としては、上述に例示したような置換可能な基が挙げられ、好ましくは、シアン基、ニトロ基、ハロゲン原子、カルボキシ基、アルコキシカルボニル基、アリールオキシカルボニル基、アラキルオキシカルボニル基等が挙げられる。

【0021】尚、本明細書において、置換可能な基のうち、「アリールオキシ基」、「アリールチオ基」、「アラキルオキシ基」、「アラキルチオ基」、「アリル基中のアリール基、アラキル基」、「アリール基」、「アラキル基」、「アリールオキシカルボニル基」、「アラキルオキシカルボニル基」、「アリールスルフィニル基」、「アラキルスルフィニル基」、「アリールスルホニル基」、「アラキルスルホニル基」の中の「アリール基」の置換/結合部位としては、芳香環構成成分中、置換/結合可能な元素であればいかなる位置でもよい基を包含する概念として用いる。

【0022】本発明の前記一般式(1)で示される化合物は不斉炭素を有し、光学異性体、ジアステロ異性体、幾何異性体などの立体異性体が存在するが、これら異性体及びその混合物、並びにそれらの塩も本発明の範囲に包含される。

【0023】本発明の前記一般式(1)で示される化合物は、所望により塩、好ましくは薬理学的に許容する塩に変換することができ、又、生成した塩から遊離形態の化合物に変換することもできる。本発明の前記一般式(1)で示される化合物の塩としては、酸付加塩又はアルカリ付加塩が挙げられ、酸付加塩としては、例えば、塩酸塩、臭化水素酸塩、硝酸塩、硫酸塩、ヨウ化水素酸塩、リン酸塩等の酸塩、プロピオン酸塩、酪酸塩、ギ酸塩、吉草酸塩、ピルリル酸塩、トリフルオロ酢酸塩、アクリル酸塩、マレイン酸塩、酒石酸塩、クエン酸

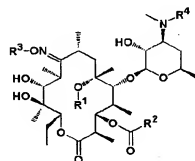
塩、オレイン酸塩、ラウリン酸塩、ステアリン酸塩、コハク酸塩、ラクトビオン酸塩、グルタル酸塩、セバシン酸塩、グルコン酸塩、安息香酸塩、メタンスルホン酸塩、エタンスルホン酸塩、2-ヒドロキシエタンスルホン酸塩、ベンゼンスルホン酸塩、フタル酸塩、クイ酸塩、p-トルエンスルホン酸塩、ラウリル硫酸塩、グルセプト酸塩、リンゴ酸塩、マロン酸塩、アスパラギン酸塩、グルタミン酸塩、アジピン酸塩、シュウ酸塩、ニコチン酸塩、ピクリン酸塩、チオシアン酸塩、ウンデカン酸塩、マンデル酸塩、フマル酸塩、10-カンファースルホン酸塩、乳酸塩、5-オキソテトラヒドロフラン-2-カルボン酸塩、2-ヒドロキシグルタル酸塩等の有機酸塩が、アルカリ付加塩としては、例えば、ナトリウム塩、カリウム塩、カルシウム塩、マグネシウム塩、アンモニウム塩等の無機アルカリ塩、エタノールアミン塩、N, N-ジアルキルエタノールアミン塩等の有機塩の塩が挙げられる。

【0024】本発明の前記一般式(1)で示される化合物又はその塩は、製造条件により任意の結晶形として、又、任意の水和物もしくは有機溶媒の溶媒和物として存在することができるが、これらの結晶形、水和物、溶媒和物及びそれらの混合物も本発明の範囲に包含される。

【0025】本発明の好ましい化合物としては、以下に記載する化合物が挙げられるが、本発明はこれらに限定されるものではない。尚、表中に示したMeはメチル基、Etはエチル基、n-Prはn-プロピル基、i-Prはイソプロピル基、n-Buはn-ブチル基、i-Buはイソブチル基、sec-Buはsec-ブチル基、tert-Buはtert-ブチル基、n-Pentはn-ペンチル基、i-Pentはイソペンチル基、neo-Pentはネオペンチル基、tert-Pentはtert-ペンチル基、n-Hexはn-ヘキシル基、n-Heptはn-ヘプチル基、n-Octはn-オクチル基、n-Nonはn-ノニル基、n-Decはn-デシル基、n-Undecはn-ウンデシル基、n-Dodecはn-ドデシル基、Acはアセチル基を表す。



【0026】

【化3】



【0027】

【表1】

化合物 番号	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>
1	H	Et	Me
2	H	Et	Et
3	H	Et	n-Pr
4	H	Et	i-Pr
5	H	Et	n-Bu
6	H	Et	n-Pent
7	H	Et	n-Hex
8	H	Et	n-Hept
9	H	Et	n-Oct
10	H	Et	n-Non
11	H	Et	n-Dec
12	H	Et	n-Undec
13	H	Et	n-Dodec
14	H	Et	
15	H	Et	

【0028】































【表2】



化合物 番号	R <sup>1</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>
16	H	Et		
17	H	Et		
18	H	Et		
19	H	Et		
20	H	Et		
21	H	Et		
22	H	Et		
23	H	Et		
24	H	Et		
25	H	Et		
26	H	Et		
27	H	Et		
28	H	Et		
29	H	Et		
30	H	Et		































【0029】

【表3】

化合物 番号	R <sup>1</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>
31	H	Et		
32	H	Et		
33	H	Et		
34	H	Et		
35	H	Et		
36	H	Et		
37	H	Et		
38	H	Et		
39	H	Et		
40	H	Et		
41	H	Et		
42	H	Et		
43	H	Et		
44	H	Et		
45	H	Et		









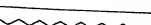







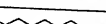









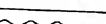

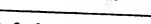

【0030】

【表4】

化合物 番号	R <sup>1</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>
46	H	Et		
47	H	Et		
48	H	Et		
49	H	Et		
50	H	Et		
51	H	Et		
52	H	Et		
53	H	Et		
54	H	Et		
55	H	Et		
56	H	Et		
57	H	Et		
58	H	Et		
59	H	Et		
60	H	Et		

[0031]

【表5】

化合物 番号	R <sup>1</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>
61	H	Et	 OMe	
62	H	Et	 O-n-Hex	
63	H	Et	 O-n-Dodec	
64	H	Et	 OMe	
65	H	Et	 OMe	
66	H	Et	 SMe	
67	H	Et	 S-n-Hex	
68	H	Et	 S-n-Dodec	
69	H	Et	 SMe	
70	H	Et	 SMe	
71	H	Et	 NHMe	
72	H	Et	 NH-n-Hex	
73	H	Et	 NH-n-Dodec	
74	H	Et	 NHMe	
75	H	Et	 NHMe	































[0032]

【表6】

化合物 番号	R <sup>1</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>
76	H	Et		
77	H	Et		
78	H	Et		
79	H	Et		
80	H	Et		
81	H	Et		
82	H	Et		
83	H	Et		
84	H	Et		
85	H	Et		
86	H	Et		
87	H	Et		
88	H	Et		
89	H	Et		
90	H	Et		


























[0033]

【表7】

化合物 番号	R <sup>1</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>
91	H	Et		
92	H	Et		
93	H	Et		
94	H	Et		
95	H	Et		
96	H	Et		
97	H	Et		
98	H	Et		
99	H	Et		
100	H	Et		
101	H	Et		
102	H	Et		
103	H	Et		
104	H	Et		
105	H	Et		























【0034】

【表8】

化合物 番号	R <sup>1</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>
106	H	Et		
107	H	Et		
108	H	Et		
109	H	Et		
110	H	Et		
111	H	Et		
112	H	Et		
113	H	Et		
114	H	Et		
115	H	Et		
116	H	Et		Me
117	H	Et		Et
118	H	Et		n-Pr
119	H	Et		i-Pr
120	H	Et		n-Bu

【0035】
























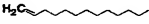
【表9】

化合物 番号	R <sup>1</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>
121	H	Et		i-Bu
122	H	Et		sec-Bu
123	H	Et		tert-Bu
124	H	Et		n-Pent
125	H	Et		i-Pent
126	H	Et		neo-Pent
127	H	Et		tert-Pent
128	H	Et		
129	H	Et		
130	H	Et		
131	H	Et		n-Hex
132	H	Et		
133	H	Et		
134	H	Et		
135	H	Et		

[0036]




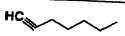

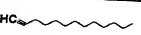
























【表10】



化合物 番号	R <sup>1</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>
136	H	Et		
137	H	Et		
138	H	Et		
139	H	Et		
140	H	Et		
141	H	Et		
142	H	Et		n-Hept
143	H	Et		n-Oct
144	H	Et		n-Non
145	H	Et		n-Dec
146	H	Et		n-Undec
147	H	Et		n-Dodec
148	H	Et		
149	H	Et		
150	H	Et		












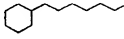

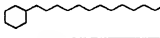
















【0037】

【表11】

化合物 番号	R <sup>1</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>
151	H	Et		
152	H	Et		
153	H	Et		
154	H	Et		
155	H	Et		
156	H	Et		
157	H	Et		
158	H	Et		
159	H	Et		
160	H	Et		
161	H	Et		
162	H	Et		
163	H	Et		
164	H	Et		
165	H	Et		


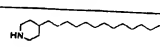




























【0038】

【表12】

化合物 番号	R <sup>1</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>
166	H	Et		
167	H	Et		
168	H	Et		
169	H	Et		
170	H	Et		
171	H	Et		
172	H	Et		
173	H	Et		
174	H	Et		
175	H	Et		
176	H	Et		
177	H	Et		
178	H	Et		
179	H	Et		
180	H	Et		































【0039】

【表13】

化合物 番号	R <sup>1</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>
181	H	Et		
182	H	Et		
183	H	Et		
184	H	Et		
185	H	Et		
186	H	Et		
187	H	Et		
188	H	Et		
189	H	Et		
190	H	Et		
191	H	Et		
192	H	Et		
193	H	Et		
194	H	Et		
195	H	Et		
















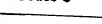



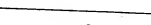










【0040】

【表14】

化合物 番号	R <sup>1</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>
196	H	Et		
197	H	Et		
198	H	Et		
199	H	Et		
200	H	Et		
201	H	Et		
202	H	Et		
203	H	Et		
204	H	Et		
205	H	Et		
206	H	Et		
207	H	Et		
208	H	Et		
209	H	Et		
210	H	Et		














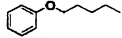









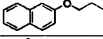



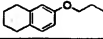


【0041】

【表15】

化合物 番号	R <sup>1</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>
211	H	Et		MeO 
212	H	Et		n-Hex-O 
213	H	Et		n-Dodec-O 
214	H	Et		MeO 
215	H	Et		MeO 
216	H	Et		MeS 
217	H	Et		n-Hex-S 
218	H	Et		n-Dodec-S 
219	H	Et		MeS 
220	H	Et		MeS 
221	H	Et		MeHN 
222	H	Et		n-Hex-HN 
223	H	Et		
224	H	Et		
225	H	Et		Me <sub>2</sub> N 


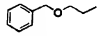

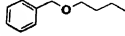

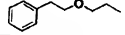

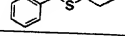

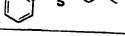

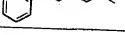







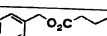

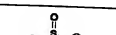


【0042】

【表16】

化合物 番号	R <sup>1</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>
226	H	Et		
227	H	Et		
228	H	Et		MeHN 
229	H	Et		MeHN 
230	H	Et		
231	H	Et		
232	H	Et		
233	H	Et		
234	H	Et		
235	H	Et		
236	H	Et		
237	H	Et		
238	H	Et		
239	H	Et		
240	H	Et		

【0043】































【表17】

化合物 番号	R <sup>1</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>
241	H	Et		
242	H	Et		
243	H	Et		
244	H	Et		
245	H	Et		
246	H	Et		
247	H	Et		$\text{F}_3\text{CF}_2\text{C}-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_3$
248	H	Et		$\text{Ac}-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_3$
249	H	Et		$\text{HO}_2\text{C}-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_3$
250	H	Et		$\text{EtO}_2\text{C}-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_3$
251	H	Et		$n\text{-Hex-O}_2\text{C}-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_3$
252	H	Et		$n\text{-Dodec-O}_2\text{C}-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_3$
253	H	Et		
254	H	Et		
255	H	Et		

【0044】

【表18】



化合物 番号	R <sup>1</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>
256	H	Et		
257	H	Et		
258	H	Et		
259	H	Et		
260	H	Et		
261	H	Et		
262	H	Et		
263	H	Et		
264	H	Et		
265	H	Et		
266	H	Et		
267	H	Et		
268	H	Et		
269	H	Et		
270	H	Et		














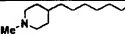

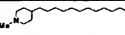

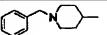





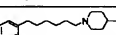


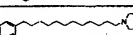





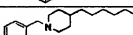


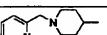

【0045】

【表19】

化合物 番号	R <sup>1</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>
271	H	Et		n-Hex-N
272	H	Et		n-Dodec-N
273	H	Et		Me-N
274	H	Et		n-Hex-N
275	H	Et		n-Dodec-N
276	H	Et		Me-N
277	H	Et		n-Hex-N
278	H	Et		n-Dodec-N
279	H	Et		Me-N
280	H	Et		n-Hex-N
281	H	Et		n-Dodec-N
282	H	Et		Me-N
283	H	Et		n-Hex-N
284	H	Et		n-Dodec-N
285	H	Et		Me-N































[0046]

【表20】

化合物 番号	R <sup>1</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>
286	H	Et		n-Hex-N 
287	H	Et		n-Dodec-N 
288	H	Et		Me-N 
289	H	Et		n-Hex-N 
290	H	Et		n-Dodec-N 
291	H	Et		Me-N 
292	H	Et		Me-N 
293	H	Et		Me-N 
294	H	Et		 -N 
295	H	Et		 -N 
296	H	Et		 -N 
297	H	Et		 -N 
298	H	Et		 -N 
299	H	Et		 -N 
300	H	Et		 -N 


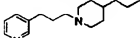

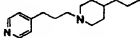

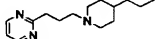

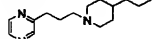

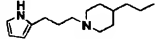

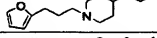

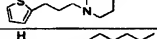

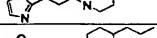

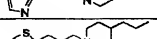

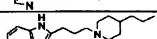

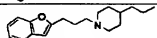

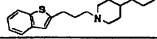

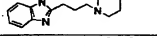

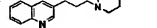


【0047】

【表21】

化合物 番号	R <sup>1</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>
301	H	Et		
302	H	Et		
303	H	Et		
304	H	Et		
305	H	Et		
306	H	Et		
307	H	Et		
308	H	Et		
309	H	Et		
310	H	Et		
311	H	Et		
312	H	Et		
313	H	Et		
314	H	Et		
315	H	Et		

【0048】

【表22】

化合物 番号	R <sup>1</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>
316	H	Et		
317	H	Et		
318	H	Et		
319	H	Et		
320	H	Et		
321	H	Et		
322	H	Et		
323	H	Et		
324	H	Et		
325	H	Et		
326	H	Et		
327	H	Et		
328	H	Et		
329	H	Et		
330	H	Et		
















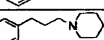

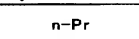








【0049】

【表23】

化合物 番号	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>
331	H	Et	
332	H	Et	
333	H	Et	
334	H	Et	
335	H	Et	
336	H	Et	
337	H	Et	
338	H	Et	
339	H	Et	
340	H	Et	
341	H	Et	
342	H	Et	
343	H	Et	
344	H	Et	
345	H	Et	








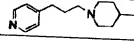













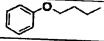

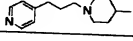


【0050】

【表24】

化合物 番号	R <sup>1</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>
346	H	Et		
347	Me	Et		n-Pr
348	Me	Et		i-Pr
349	Me	Et		
350	Me	Et		
351	Me	Et		
352	Me	Et		
353	Me	Et		
354	Me	Et		
355	Me	Et		
356	Et	Et		n-Pr
357	Et	Et		i-Pr
358	Et	Et		
359	Et	Et		
360	Et	Et		

【0051】












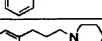

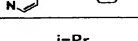













【表25】

化合物 番号	R <sup>1</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>
361	Et	Et		
362	Et	Et		
363	Et	Et		
364	Et	Et		
365	Et	n-Pr		n-Pr
366	H	n-Pr		i-Pr
367	H	n-Pr		
368	H	n-Pr		
369	H	n-Pr		
370	H	n-Pr		
371	H	n-Pr		
372	H	n-Pr		
373	H	n-Pr		
374	H	i-Pr		n-Pr
375	H	i-Pr		i-Pr

【0052】

【表26】



化合物 番号	R <sup>1</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>
376	H	i-Pr		
377	H	i-Pr		
378	H	i-Pr		
379	H	i-Pr		
380	H	i-Pr		
381	H	i-Pr		
382	H	i-Pr		
383	H	n-Hex		i-Pr
384	H	n-Dodec		i-Pr
385	H			i-Pr
386	H			i-Pr
387	H	-CH <sub>2</sub> F		i-Pr
388	H			i-Pr
389	H			i-Pr
390	H			i-Pr

[0053]

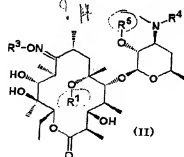
【表27】

化合物 番号	R <sup>1</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>
391	H			i-Pr
392	H			i-Pr
393	H			i-Pr
394	H			i-Pr
395	H			i-Pr
396	H			i-Pr
397	H			i-Pr
398	H			i-Pr
399	H			i-Pr
400	H			i-Pr
401	H			i-Pr
402	H			i-Pr
403	H			i-Pr
404	H			i-Pr
405	H			i-Pr
406	H			i-Pr

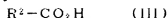
【0054】本発明の前記一般式(I)で示される新規なエリスロマイシン誘導体は、例えば以下の方法により製造することができるが、本発明化合物の製造方法はこれらの方法に限定されるわけではない。

【0055】本発明化合物の製造方法の第一の様式によれば、前記一般式(I)で示される化合物は、次の一般式(II)

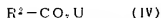
【化4】



(式中、R<sup>5</sup>は水素原子又は水酸基の保護基を表し、R<sup>1</sup>、R<sup>3</sup>及びR<sup>4</sup>は前述と同意義を表す。)で示される化合物と、次の一般式(III)



(式中、 $R^2$ は前述と同意義を表す。)で示されるカルボン酸誘導体及び縮合剤を、塩基の存在下又は非存在下、無溶媒又は溶媒中で反応させ、更に必要に応じて脱保護することにより製造するか、あるいは、次の一般式(IV)



(式中、Uは酸無水物残基を表し、 $R^2$ は前述と同意義を表す。)で示される酸無水物、又は次の一般式(V)  
 $R^2-COW \quad (V)$

(式中、Wはハロゲン原子を表し、 $R^2$ は前述と同意義を表す。)で示される酸ハライド誘導体を、塩基の存在下又は非存在下、無溶媒又は溶媒中で反応させ、更に必要に応じて脱保護することにより製造することができる。

【0056】本製造方法において使用される縮合剤としては、例えば、1, 3-ジシクロヘキシルカルボジミド、1-エチル-3-(3-ジメチルアミノプロピル)カルボジミド塩酸塩、1, 1'-カルボニルジメタゾール、ウッドワード試薬K(2-エチル-5-フェニルイソキサゾリウム-3'-ニルホスヒド)等が挙げられ、使用される塩基としては、例えば、トリエチルアミン、N-ジイソプロピルエチルアミン、4-ジメチルアミノピリジン、1, 8-ジアザビシクロ[5.4.0]-7-ウンデセン、1, 2, 2, 6, 6-ペンタメチルピペリジン等の有機塩基、又は炭酸ナトリウム、炭酸カリウム、炭酸水素ナトリウム、炭酸水素カリウム等の無機塩基が挙げられる。使用される溶媒は、それ自体反応において不活性であって、且つ反応を阻害しないものであればいかなるものでもよく、例えば、ジクロロメタン、1, 2-ジクロロエタン、クロロホルム等のハロゲン化炭化水素系溶媒、ベンゼン、トルエン等の芳香族炭化水素系溶媒、アセトン、アセトニトリル、N、N-ジメチルホルムアミド、N-メチル-2-ピロリドン、ジメチルスルホキシド、テトラメチレンスルホラン、テトラメチレンスルホキシド、ヘキサメチレンスルホトリアミド等の非プロトン性極性溶媒、酢酸メチル、酢酸エチル等のエステル系溶媒、テトラヒドロフラン、ジエチルエーテル、1, 4-ジオキサン等のエーテル系溶媒、ヒロジン、ピコリン、ルチジン、コリン等の有機塩基系溶媒又はこれらの混合溶媒が挙げられる。又、反応は氷冷下から200℃までの範囲で行われる。

【0057】本製造方法における脱保護反応は、水酸基の保護基 $R^5$ の種類に応じて種々の方法により行うことができ、一例として、次のような方法を用いることができる。例えば、水酸基の保護基 $R^5$ がアルカノイル基、ハロゲンアルカノイル基、アリールカルボニル基のようなエステルを形成する保護基の場合には、無溶媒又は溶媒中、酸もしくはアルカリの存在下又は非存在下、加水分解することにより製造することができる。エステルの

加水分解はそれ自体公知の方法で、酸性加水分解には、例えば、塩酸、硫酸等の酸を用いることができ、アルカリ性加水分解には、例えば、炭酸水素ナトリウム、炭酸ナトリウム、水酸化ナトリウム、水酸化リチウム、水酸化バリウム、メトキシナトリウム、エトキシナトリウム、tert-ブトキシナトリウム、tert-ブトキシカリウム等のアルカリを用いることができる。これらの酸又はアルカリは水溶液として用いることもできるが、メタノール、エタノール、n-プロパノール、イソプロピルアルコール、n-ブタノール、sec-ブチルアルコール、tert-ブチルアルコール等のアルコール系溶媒、アセトン、アセトニトリル、N、N-ジメチルホルムアミド、ジメチルスルホキシド、テトラメチレンスルホラン、テトラメチレンスルホキシド、ヘキサメチレンスルホトリアミド等の非プロトン性極性溶媒、テトラヒドロフラン、ジエチルエーテル、1, 4-ジオキサン等のエーテル系溶媒又はこれらの含水溶媒等を用いることができる。又、反応は氷冷下から200℃までの範囲で行われる。

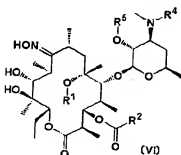
【0058】又、水酸基の保護基 $R^5$ がアルコキシカルボニル基、アリールオキシカルボニル基、アラキルオキシカルボニル基等のようなカーボネートを形成する保護基の場合には、無溶媒又は溶媒中、カチオンスカベンジャーの存在下又は非存在下で加水素分解し、脱保護することにより製造することができる。使用される溶媒は、それ自体反応において不活性であって、且つ反応を阻害しないものであればいかなるものでもよく、例えば、水、酢酸、メタノール、エタノール、n-プロパノール、イソプロピルアルコール、n-ブタノール、sec-ブチルアルコール、tert-ブチルアルコール等のアルコール系溶媒、ジクロロメタン、1, 2-ジクロロエタン、クロロホルム等のハロゲン化炭化水素系溶媒、ベンゼン、トルエン等の芳香族炭化水素系溶媒、アセトン、アセトニトリル、N、N-ジメチルホルムアミド、N-メチル-2-ピロリドン、ジメチルスルホキシド、テトラメチレンスルホラン、テトラメチレンスルホキシド、ヘキサメチレンスルホトリアミド等の非プロトン性極性溶媒、酢酸メチル、酢酸エチル等のエステル系溶媒、テトラヒドロフラン、ジエチルエーテル、1, 4-ジオキサン等のエーテル系溶媒又はこれらの混合溶媒等が挙げられる。使用されるカチオンスカベンジャーとしては、例えば、アニソール、チオアニソール、エタンチオール等が挙げられ、使用される酸としては、例えば、塩酸、臭化水素酸、トリフルオロ酢酸、酢酸、硫酸等が挙げられる。又、反応は氷冷下から200℃までの範囲で行われる。加水素分解に用いられる触媒としては、例えば、5%パラジウム/炭素、10%パラジウム/炭素、20%水酸化パラジウム/炭素等のパラジウム系の触媒又は酸化白金等が挙げられる。水素源としては水素ガスの他、シクロヘキセン、1, 3-シクロヘキサジエン、キ酸、キ酸

アンモニウム等を用いることができる。又、反応は室温から200℃の範囲で行われ、水素源として水素ガスをを用いる場合は、水素圧は常圧から200Paの範囲で行われる。

【0059】又、水酸基の保護基 $R^5$ がトリアルキシル型の保護基の場合には、無溶媒又は溶媒中、酸又はフッ化テトラブチルアンモニウムを作用させ、脱保護することにより製造することができる。使用される溶媒は、それ自体反応において不活性であって、且つ反応を阻害しないものであればいかなるものでもよく、例えば、水、酢酸、メタノール、エタノール、*n*-プロパノール、イソプロピルアルコール、*n*-ブタノール、*sec*-ブチルアルコール、*tert*-ブチルアルコール等のアルコール系溶媒、ジクロロメタン、1, 2-ジクロロエタン、クロロホルム等のハロゲン化炭化水素系溶媒、ベンゼン、トルエン等の芳香族炭化水素系溶媒、アセトン、アセトニトリル、*N*, *N*-ジメチルホルムアミド、*N*-メチル-2-ピロリドン、ジメチルスルホキシド、テトラメチレンスルホラン、テトラメチレンスルホキシド、ヘキサメチレンスルホリクトリアミド等の非プロトン性極性溶媒、酢酸メチル、酢酸エチル等のエステル系溶媒、テトラヒドロフラン、ジエチルエーテル、1, 4-ジオキサン等のエーテル系溶媒又はこれらの混合溶媒等が挙げられ、使用される酸としては、例えば、フッ化水素酸、塩酸、臭化水素酸、硫酸等の鉱酸、トリフルオロ酢酸、酢酸、*p*-トルエンсульホン酸、クエン酸、シュウ酸等の有機酸が挙げられる。又、反応は氷冷下から200℃までの範囲で行われる。

【0060】本発明化合物の製造方法の第二の様式によれば、前記一般式(Ⅰ)で示される化合物は、次の一般式(VI)

【化5】



(V)

(式中、 $R^1$ ,  $R^2$ ,  $R^4$ 及び $R^5$ は前述と同意義を表す。で示される化合物と、次の一般式(VII)

$R^3-Q$  (VII)

(式中、Qはハロゲン原子、メシルオキシ基、トシルオキシ基又はトリフルオロメチルスルホンオキシ基を表し、 $R^3$ は前述と同意義を表す。)で示される化合物及びヨウ化テトラブチルアンモニウムを、ヨウ化ナトリウムもしくは塩基の存在下又は非存在下、無溶媒又は溶媒中で反応させ、更に必要に応じて脱保護することにより

製造することができる。

【0061】本製造方法において使用される塩基としては、例えば、トリエチルアミン、*N*, *N*-ジイソプロピルエチルアミン、4-ジメチルアミノピリジン、1, 8-ジアザビシクロ[5.4.0]-7-ウンテン、1, 2, 2, 6, 6-ペンタメチルピペリジン等の有機塩基、又は炭酸ナトリウム、炭酸カリウム、炭酸水素ナトリウム、炭酸水素カリウム、水素化ナトリウム、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム等の無機塩基が挙げられる。使用される溶媒は、それ自体反応において不活性であって、且つ反応を阻害しないものであればいかなるものでもよく、例えば、ジクロロメタン、1, 2-ジクロロエタン、クロロホルム等のハロゲン化炭化水素系溶媒、ベンゼン、トルエン等の芳香族炭化水素系溶媒、アセトン、アセトニトリル、*N*, *N*-ジメチルホルムアミド、*N*-メチル-2-ピロリドン、ジメチルスルホキシド、テトラメチレンスルホラン、テトラメチレンスルホキシド、ヘキサメチレンスルホリクトリアミド等の非プロトン性極性溶媒、酢酸メチル、酢酸エチル等のエステル系溶媒、テトラヒドロフラン、ジエチルエーテル、1, 4-ジオキサン等のエーテル系溶媒、ヒリジン、ピコリン、ルチジン、コリジン等の有機塩基系溶媒又はこれらの混合溶媒等が挙げられる。又、反応は氷冷下から200℃までの範囲で行われる。

【0062】本製造方法における脱保護反応は水酸基の保護基 $R^5$ の種類に応じて種々の方法を用いることができ、先に記載した第一の製造様式の方法に準じて行うことができる。

【0063】本発明化合物の製造方法の第三の様式によれば、前記一般式(Ⅰ)で示される化合物のうち、 $R^3$ がアルコキシ基で置換されたシクロアルキル基である化合物は、前記一般式(VI)で示される化合物と、次の一般式(VIII)

【化6】



(式中、 $R^6$ 及び $R^7$ は各々独立してアルコキシ基を表し、 $m$ は1以上の整数を表す。)で示されるシクロアルキル化合物、又は次の一般式(IX)

【化7】



(式中、 $R^8$ はアルコキシ基を表し、 $p$ は1以上の整数を表す。)で示されるシクロアルケン化合物を、炭酸塩の存在下又は非存在下、無溶媒又は溶媒中で反応させ、更に必要に応じて脱保護することにより製造することができる。

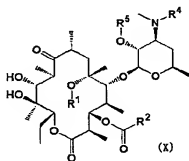
【0064】本製造方法において使用される酸としては、例えば、ヒリジン塩酸塩、ヒリジントリフルオロ酢酸塩、ヒリジン-*p*-トルエンсульホン酸塩等が挙げられ、

使用される溶媒としては、それ自体反応において不活性であって、且つ反応を阻害しないものであればいかなるものでもよく、例えば、ジクロロメタン、1, 2-ジクロロエタン、クロロホルム等のハロゲン化炭化水素系溶媒、ベンゼン、トルエン等の芳香族炭化水素系溶媒、アセトン、アセトニトリル、N, N-ジメチルホルムアミド、N-メチル-2-ピロリドン、ジメチルスルホキシド、テトラメチレンスルホラン、テトラメチレンスルホキシド、ヘキサメチレンホスホリクトリアミド等の非プロトン性極性溶媒、酢酸メチル、酢酸エチル等のエステル系溶媒、テトラヒドロフラン、ジエチルエーテル、1, 4-ジオキサン等のエーテル系溶媒又はこれらの混合溶媒等が挙げられる。又、反応は氷冷下から20℃までの範囲で行われる。

【0065】本製造方法における脱保護反応は水酸基の保護基R<sup>4</sup>の種類に応じて種々の方法を用いることができ、先に記載した第一の製造様式の方法に準じて行うことができる。

【0066】本発明化合物の製造方法の第四の様式によれば、前記一般式(1)で示される化合物は、次の一般式(X)

【化8】



(式中、R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, R<sup>4</sup>及びR<sup>5</sup>は前述と同意義を表す)

R<sup>3</sup>で示される化合物と、次の一般式(XI)

R<sup>3</sup>-O-NH<sub>2</sub> (XI)

(式中、R<sup>3</sup>は前述と同意義を表す。)で示されるヒドロキシアルミン誘導体又はその塩を、塩基の存在下又は非存在下、無溶媒又は溶媒中で反応させ、更に必要に応じて脱保護することにより製造することができる。

【0067】本製造方法において使用される塩基としては、例えば、トリエチルアミン、イミダゾール、N, N-ジイソプロピルエチルアミン、4-ジメチルアミノピリジン、1, 8-ジアザビシクロ[5.4.0]-7-アウテン-1, 2, 2, 6, 6-ペンタメチルピペリジン等の有機塩基、又は炭酸ナトリウム、炭酸カリウム、炭酸水素ナトリウム、炭酸水素カリウム等の無機塩基が挙げられる。使用される溶媒は、それ自体反応において不活性であって、且つ反応を阻害しないものであればいかなるものでもよく、例えば、メタノール、エタノール、n-プロパノール、イソプロピルアルコール、n-ブタノール、sec-ブチルアルコール、tert-ブチルアルコ

ール等のアルコール系溶媒、ジクロロメタン、1, 2-ジクロロエタン、クロロホルム等のハロゲン化炭化水素系溶媒、ベンゼン、トルエン等の芳香族炭化水素系溶媒、アセトン、アセトニトリル、N, N-ジメチルホルムアミド、N-メチル-2-ピロリドン、ジメチルスルホキシド、テトラメチレンスルホラン、テトラメチレンスルホキシド、ヘキサメチレンホスホリクトリアミド等の非プロトン性極性溶媒、酢酸メチル、酢酸エチル等のエステル系溶媒、テトラヒドロフラン、ジエチルエーテル、1, 4-ジオキサン等のエーテル系溶媒、ヒリジン、ピコリン、ルチジン、コリジン等の有機塩基系溶媒又はこれらの混合溶媒等が挙げられる。又、反応は氷冷下から20℃までの範囲で行われる。

【0068】本製造方法における脱保護反応は、水酸基の保護基R<sup>5</sup>の種類に応じて種々の方法を用いることができ、先に記載した第一の製造様式の方法に準じて行うことができる。

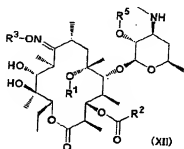
【0069】本発明化合物の製造方法の第五の様式によれば、前記一般式(1)中、R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup>又はR<sup>4</sup>で示される置換基中にアルミノ基又はアミノ基を有する化合物は、第一の第四の様式により製造されるR<sup>2</sup>, R<sup>3</sup>又はR<sup>4</sup>で示される置換基中にニトロ基を有する化合物を、アシル化剤の存在下あるいは非存在下、酸の存在下あるいは非存在下、溶媒中金属により還元するか、又は触媒の存在下で水素添加することにより製造することができる。

【0070】本製造方法において使用されるアシル化剤としては、例えば、塩化アセチル、塩化プロピオンリ、塩化ベンゾイル、フェニルアセチルクロリド等の酸クロリド、無水酢酸、無水プロピオン酸、無水安息香酸、無水フェニル酢酸等の酸無水物が挙げられる。使用される酸としては、例えば、塩酸、硫酸、酢酸等が挙げられ、使用される金属としては、例えば、スズ、鉄、亜鉛等の金属又はその塩が挙げられる。水素添加に用いられる触媒としては、例えば、5%パラジウム/炭素、10%パラジウム/炭素、20%水酸化パラジウム/炭素等のパラジウム系の触媒又は酸化白金等が挙げられる。水素源としては水素ガスの他、シクロヘキセン、1, 3-シクロヘキサジエン、ギ酸、ギ酸アンモニウム等を用いることができる。使用される溶媒は、それ自体反応において不活性であって、且つ反応を阻害しないものであればいかなるものでもよく、例えば、水、酢酸、メタノール、エタノール、n-プロパノール、イソプロピルアルコール、n-ブタノール、sec-ブチルアルコール、tert-ブチルアルコール等のアルコール系溶媒、ジクロロメタン、1, 2-ジクロロエタン、クロロホルム等のハロゲン化炭化水素系溶媒、ベンゼン、トルエン等の芳香族炭化水素系溶媒、アセトン、アセトニトリル、N, N-ジメチルホルムアミド、N-メチル-2-ピロリドン、ジメチルスルホキシド、テトラメチレンスルホラン、テトラメ

チレンスルホキシド、ヘキサメチレンホスホリクトリアミド等の非アロトン性極性溶媒、酢酸メチル、酢酸エチル等のエステル系溶媒、テトラヒドロフラン、ジエチルエーテル、1, 4-ジオキサン等のエーテル系溶媒又はこれらの混合溶媒等が挙げられる。又、反応は室温から200℃の範囲で行われ、水素源として水素ガスを用いる場合は、水素圧は常圧から200Paの範囲で行われる。

【0071】本発明化合物の製造方法の第六の様式によれば、前記一般式(1)で示される化合物は、次の一般式(XII)

【化9】



(式中、 $R^1$ ,  $R^2$ ,  $R^3$ 及び $R^5$ は前述と同意義を表す。)で示される化合物と、次の一般式(XIII)

$R^4-Q$  (XIII)

(式中、 $R^4$ 及び $Q$ は前述と同意義を表す。)で示される化合物を、塩基の存在下又は非存在下、無溶媒又は溶媒中で反応させ、更に必要に応じて脱保護することにより製造するか、又は次の一般式(XIV)

$R^3-C-HO$  (XIV)

(式中、 $R^3$ は置換基を有してもよいアルキル基、置換基を有してもよいアルケニル基、置換基を有してもよいアルキニル基、置換基を有してもよい同素もしくは複素環基又は置換基を有してもよい同素もしくは複素環置換アルキル基を表す。)で示される化合物を、無溶媒又は溶媒中で反応させ、続いて $R^4$ 又は水素化ホウ素化合物で処理し、更に必要に応じて脱保護することにより製造することができる。

【0072】本製造方法において、前記一般式(XIII)を用いる場合に使用される塩基としては、例えば、トリエチルアミン、 $N$ ,  $N$ -ジイソプロピルエチルアミン、4-ジメチルアミノピリジン、1, 8-ジビザビシクロ[5.4.0]-7-ウンデセン、1, 2, 2, 6, 6-ペンタメチルピペリジン等の有機塩基、又は炭酸ナトリウム、炭酸カリウム、炭酸水素ナトリウム、炭酸水素カリウム等の無機塩基が挙げられる。使用される溶媒は、それ自体反応において不活性であって、且つ反応を阻害しないものであればいかなるものでもよく、例えば、ジクロロメタン、1, 2-ジクロロエタン、クロロホルム等のハロゲン化炭化水素系溶媒、ベンゼン、トルエン等の芳香族炭化水素系溶媒、アセトン、アセトニ

リル、 $N$ ,  $N$ -ジメチルホルムアミド、 $N$ -メチル-2-ピロリドン、ジメチルスルホキシド、テトラメチレンスルホラン、テトラメチレンスルホキシド、ヘキサメチレンホスホリクトリアミド等の非アロトン性極性溶媒、酢酸メチル、酢酸エチル等のエステル系溶媒、テトラヒドロフラン、ジエチルエーテル、1, 4-ジオキサン等のエーテル系溶媒、ピリジン、ピコリン、ルチジン、コリジン等の有機塩基系溶媒又はこれらの混合溶媒等が挙げられる。又、反応は氷冷下から200℃までの範囲で行われる。

【0073】本製造方法において、前記一般式(XIV)

を用いる場合に使用される水素化ホウ素化合物としては、例えば、水素化ホウ素ナトリウム、トリメトキシ水素化ホウ素ナトリウム、シアン化水素化ホウ素ナトリウム、トリアセトキシ水素化ホウ素ナトリウム、水素化ホウ素リチウム、水素化ホウ素カリウム等が挙げられる。使用される溶媒は、それ自体反応において不活性であって、且つ反応を阻害しないものであればいかなるものでもよく、例えば、水、酢酸、メタノール、エタノール、 $n$ -プロパノール、イソプロピルアルコール、 $n$ -ブタノール、 $sec$ -ブチルアルコール、 $tert$ -ブチルアルコール等のアルコール系溶媒、ジクロロメタン、1, 2-ジクロロエタン、クロロホルム等のハロゲン化炭化水素系溶媒、ベンゼン、トルエン等の芳香族炭化水素系溶媒、アセトン、アセトニトリル、 $N$ ,  $N$ -ジメチルホルムアミド、 $N$ -メチル-2-ピロリドン、ジメチルスルホキシド、テトラメチレンスルホラン、テトラメチレンスルホキシド、ヘキサメチレンホスホリクトリアミド等の非アロトン性極性溶媒、酢酸メチル、酢酸エチル等のエステル系溶媒、テトラヒドロフラン、ジエチルエーテル、1, 4-ジオキサン等のエーテル系溶媒又はこれらの混合溶媒等が挙げられる。又、反応は氷冷下から200℃の範囲で行われる。

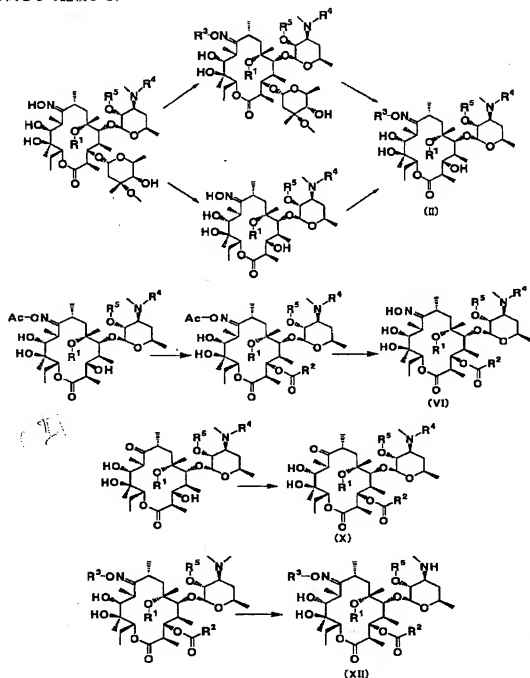
【0074】本製造方法における脱保護反応は、水酸基の保護基 $R^6$ の種類に応じて種々の方法を用いることができ、先に記載した第一の製造様式の方法に準じて行うことができる。

【0075】尚、本発明化合物の製造方法において出発原料となった前記一般式(II), (VI), (X)及び(XII)で示される化合物は、例えば、WO93/13116号、特開平8-104638号、ジャーナル・オブ・メディカル・ケミストリー (Journal of Medicinal Chemistry), 第17巻, 953頁(1974年)、ザ・ジャーナル・オブ・オーガニック・ケミストリー (The Journal of Organic Chemistry), 第57巻, 4361頁(1992年)等に記載の方法等に従い、以下の様にして製造することができる。更に、以下の製造工程において、前記一般式(II), (VI), (X)及び(XII)で示される化合物のうち、 $R^6$ が水酸基の保護基である化合物は、製造工程中適宜、 $R^6$ が水素原子であ

る化合物に保護基を導入することによっても製造することができる。これらのうち、新規な化合物については、その詳細を参考例として記載した。

【0076】

【化10】



(式中、Acはアセチル基を表し、 $R^1$ ,  $R^2$ ,  $R^3$ ,  $R^4$ 及び $R^5$ は前述と同意義を表す。)

【0077】このようにして製造される前記一般式(I)で示される新規なエリスロマイシン誘導体又はその塩の少なくとも1つを有効成分として含有する医薬は、通常、カプセル剤、錠剤、細粒剤、顆粒剤、散剤、シロップ剤等の経口剤、あるいは注射剤、坐剤、点眼剤、眼軟膏剤、点耳剤、点鼻剤又は外皮用剤として投与される。これらの製剤は、薬理学的、製剤学的に許容する添加剤を加え、常法により製造することができる。即ち経口剤及び坐剤にあっては、賦形剤(乳糖、白糖、

D-マンニトール、トウモロコシデンプン、結晶セルロース等)、崩壊剤(カルボキシメチルセルロース、カルボキシメチルセルロースカルシウム、部分アルファー化デンプン、クロスカルメロースナトリウム、クロスボビドン等)、結合剤(ヒドロキシプロピルセルロース、ヒドロキシプロピルメチルセルロース、ポリビニルピロリドン等)、滑沢剤(ステアリン酸マグネシウム、タルク、硬化油、ジメチルポリシロキサン、含水二酸化ケイ素、軽質無水ケイ酸、カルナウバロウ等)、コーティング剤(ヒドロキシプロピルメチルセルロース、白糖、酸化チタン等)、可塑剤(クエン酸トリエチル、ポリエチ

レングリコール、グリセリン脂肪酸エステル等)、基剤(ポリエチレングリコール、ハードファット等)等の製剤用成分が、注射剤、点眼剤又は点耳剤等にあつては水性あるいは用時溶解型製剤を構成する溶解剤ないしは溶解補助剤(注射用蒸留水、生理食塩水、プロピレングリコール等)、pH調節剤(無機又は有機の酸あるいは塩基等)、等張化剤(食塩、ブドウ糖、グリセリン等)、安定化剤等の製剤用成分が、又、眼軟膏剤、外用剤にあつては、軟膏剤、クリーム剤、貼付剤として適切な製剤用成分(白色ワセリン、マクロゴール、グリセリン、流動パラフィン、綿布等)が使用される。

【0078】本発明化合物を患者へ投与する場合は、患者の症状にもよるが、通常成人の場合、1日量として経口投与で10~2000mg程度、非経口投与で1~1000mg程度を1日1回から数回に分けて投与することができる。もっとも、治療又は予防の目的、感染の部位や病原菌の種類、患者の年齢や症状などに応じて、適宜増減することが望ましい。

#### 【0079】

【実施例】以下、本発明を参考例及び実施例によって説明するが、本発明はこれらの例に限定されるものではない。尚、表中に示したMeはメチル基、Etはエチル基、n-Prはn-プロピル基、i-Prはイソプロピル基、n-Buはn-ブチル基、i-Buはイソブチル基、sec-Buはsec-ブチル基、i-Pentはイソペンチル基、n-Hexはn-ヘキシル基、n-Octはn-オクチル基、n-Dodecはn-ドデシル基、Acはアセチル基、Bocはtert-ブトキシカルボニル基を表す。

#### 【0080】参考例1

3'-N-デメチル-3'-N-エチルエリスロマイシンA 9-[O-[3-(4-ヒリジル)プロピル]オキシム]

3'-N-デメチル-3'-N-エチルエリスロマイシンA 9-オキシム0.50g、ヨウ化テトラブチルアンモニウム12.0mg及び3-(4-ヒリジル)プロピルメタンスルホネート塩酸塩0.25gのテトラヒドロフラン5ml混合液に室温攪拌下、粉末水酸化カリウム0.16gを加え、室温で14時間攪拌した。反応液へ水及びジイソプロピルエーテルを加え、析出した固体を濾取し、無色固体0.42gを得た。

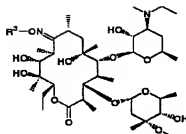
NMRスペクトル  $\delta$  (CDCl<sub>3</sub>) ppm: 0.85(3H, t, J=7.5Hz), 1.00-1.84(31H, m), 1.04(3H, d, J=6.5Hz), 1.07(3H, t, J=7Hz), 1.87-2.05(4H, m), 2.18(1H, d, J=10.5Hz), 2.23(3H, s), 2.32-2.43(1H, m), 2.36(1H, d, J=15.5Hz), 2.45-2.53(1H, m), 2.55-2.65(1H, m), 2.66-2.74(3H, m), 2.86-2.96(1H, m), 3.01(1H, t, J=10Hz), 3.07(1H, s), 3.22(1H, dd, J=10.7, 5Hz), 3.32(3H, s), 3.44-3.54(1H, m), 3.56-3.63(2H, m), 3.65-3.74(1H, m), 3.69(1H, s), 3.96-4.10(4H, m), 4.34(1H, s), 4.44(1H, d, J=7.5Hz), 4.92(1H, d, J=5Hz), 5.11(1H, dd, J=11.2Hz), 7.13(2H, d, J=6Hz), 8.50(2H, d, J=6Hz)

【0081】参考例1と同様にして、参考例2~参考例31の化合物を得た。

#### 【0082】

【表28】





参考例	R <sup>2</sup>	性状及び物性
2	Me	無色固体 NMR スペクトル δ (CDCl <sub>3</sub> )ppm:0.85(3H,t,J=7.5Hz),1.03(3H,d,J=6.5Hz),1.07(3H,t,J=7Hz),1.09-1.82(31H,m),1.87-2.05(2H,m),2.17(1H,d,J=10.5Hz),2.23(3H,s),2.32-2.43(1H,m),2.37(1H,d,J=15.5Hz),2.44-2.53(1H,m),2.56-2.71(2H,m),2.87-2.96(1H,m),3.02(1H,t,J=10Hz),3.10(1H,s),3.22(1H,dd,J=10.5,7.5Hz),3.32(3H,s),3.44-3.55(1H,m),3.59(1H,d,J=7.5Hz),3.60(1H,s),3.63-3.74(1H,m),3.68(1H,s),3.82(3H,s),3.97-4.09(1H,m),4.05(1H,d,J=8.5Hz),4.40(1H,s),4.44(1H,d,J=7.5Hz),4.93(1H,d,J=5Hz),5.11(1H,dd,J=11,2Hz)
3	Et	無色固体 NMR スペクトル δ (CDCl <sub>3</sub> )ppm:0.84(3H,t,J=7.5Hz),1.00-1.70(33H,m),1.03(3H,d,J=6.5Hz),1.07(3H,t,J=7Hz),1.78(1H,brs),1.87-2.05(2H,m),2.18(1H,d,J=10.5Hz),2.23(3H,s),2.32-2.43(1H,m),2.37(1H,d,J=15.5Hz),2.45-2.54(1H,m),2.56-2.70(2H,m),2.86-2.96(1H,m),3.02(1H,t,J=10Hz),3.11(1H,s),3.22(1H,dd,J=10,7.5Hz),3.32(3H,s),3.43-3.62(2H,m),3.59(1H,d,J=7.5Hz),3.65-3.75(1H,m),3.68(1H,s),3.97-4.11(4H,m),4.44(1H,d,J=7.5Hz),4.46(1H,s),4.93(1H,d,J=5Hz),5.11(1H,dd,J=11,2.5Hz)
4	n-Pr	無色固体 NMR スペクトル δ (CDCl <sub>3</sub> )ppm:0.84(3H,t,J=7.5Hz),0.94(3H,t,J=7.5Hz),0.98-1.71(38H,m),1.76(1H,brs),1.87-2.05(2H,m),2.18(1H,d,J=10.5Hz),2.23(3H,s),2.32-2.42(1H,m),2.37(1H,d,J=14.5Hz),2.45-2.52(1H,m),2.55-2.70(2H,m),2.86-2.96(1H,m),3.02(1H,t,J=10Hz),3.11(1H,s),3.22(1H,dd,J=10.5,7.5Hz),3.32(3H,s),3.44-3.53(1H,m),3.58(1H,d,J=7.5Hz),3.60(1H,s),3.64-3.75(1H,m),3.68(1H,s),3.90-4.10(3H,m),4.05(1H,d,J=10Hz),4.44(1H,d,J=6.5Hz),4.46(1H,s),4.93(1H,d,J=5Hz),5.11(1H,dd,J=11,2Hz)



【0083】

【表29】

参考例	R <sup>3</sup>	性状及び物性
5	i-Pr	<p>無色固体</p> <p>NMR スペクトル <math>\delta</math> (CDCl<sub>3</sub>)ppm:0.84(3H,t,J=7.5Hz),0.98-1.70(36H,m),1.02(3H,d,J=7.5Hz),1.07(3H,t,J=7Hz),1.81(1H,brs),1.85-2.03(2H,m),2.20(1H,d,J=10.5Hz),2.23(3H,s),2.32-2.41(1H,m),2.37(1H,d,J=15.5Hz),2.43-2.52(1H,m),2.53-2.68(2H,m),2.85-2.94(1H,m),3.02(1H,t,J=10Hz),3.12(1H,s),3.23(1H,dd,J=10.5,7.5Hz),3.32(3H,s),3.44-3.53(1H,m),3.55-3.60(1H,m),3.58(1H,d,J=7.5Hz),3.64-3.71(1H,m),3.68(1H,s),4.00-4.07(2H,m),4.23-4.30(1H,m),4.44(1H,d,J=7.5Hz),4.53(1H,s),4.93(1H,d,J=5Hz),5.11(1H,dd,J=11,2Hz)</p>
6	n-Bu	<p>無色固体</p> <p>NMR スペクトル <math>\delta</math> (CDCl<sub>3</sub>)ppm:0.84(3H,t,J=7.5Hz),0.93(3H,t,J=7.5Hz),1.00-1.80(35H,m),1.02(3H,d,J=6.5Hz),1.07(3H,t,J=7Hz),1.86-2.05(2H,m),2.18(1H,d,J=10.5Hz),2.23(3H,s),2.30-2.42(1H,m),2.37(1H,d,J=15.5Hz),2.45-2.52(1H,m),2.55-2.70(2H,m),2.88-2.97(1H,m),3.01(1H,t,J=10.5Hz),3.11(1H,s),3.22(1H,d,J=10.5,7.5Hz),3.32(3H,s),3.46-3.52(1H,m),3.54-3.75(2H,m),3.58(1H,d,J=7.5Hz),3.68(1H,s),3.98-4.09(1H,m),4.01(2H,t,J=6.5Hz),4.05(1H,d,J=11Hz),4.44(1H,d,J=7.5Hz),4.46(1H,s),4.93(1H,d,J=4.5Hz),5.12(1H,dd,J=11,2Hz)</p>
7	i-Bu	<p>無色固体</p> <p>NMR スペクトル <math>\delta</math> (CDCl<sub>3</sub>)ppm:0.84(3H,t,J=7.5Hz),0.93(3H,d,J=6.5Hz),0.93(3H,d,J=7.5Hz),0.98-1.80(31H,m),1.03(3H,d,J=7.5Hz),1.08(3H,t,J=7Hz),1.86-2.06(3H,m),2.18(1H,d,J=10.5Hz),2.24(3H,s),2.32-2.71(4H,m),2.36(1H,d,J=15.5Hz),2.86-2.96(1H,m),3.02(1H,t,J=10Hz),3.11(1H,s),3.22(1H,dd,J=10.5,7.5Hz),3.32(3H,s),3.45-3.86(5H,m),3.59(1H,d,J=7.5Hz),3.69(1H,s),3.97-4.09(1H,m),4.04(1H,d,J=10Hz),4.40-4.48(1H,m),4.45(1H,s),4.83(1H,d,J=5Hz),5.12(1H,dd,J=11,2Hz)</p>
8	sec-Bu	<p>無色固体</p> <p>NMR スペクトル <math>\delta</math> (CDCl<sub>3</sub>)ppm:0.84(3H,t,J=7.5Hz),0.89,0.93 (total 3H,each t,J=7.5Hz),1.00-1.85(36H,m),1.02(3H,d,J=6.5Hz),1.07(3H,t,J=7.5Hz),1.87-2.05(2H,m),2.19(1H,d,J=10.5Hz),2.23(3H,s),2.31-2.42(1H,m),2.36(1H,d,J=15.5Hz),2.44-2.52(1H,m),2.55-2.69(2H,m),2.86-2.95(1H,m),3.02(1H,t,J=10Hz),3.12(1H,s),3.22(1H,dd,J=10.7,7.5Hz),3.32(3H,s),3.43-3.60(2H,m),3.58(1H,d,J=7.5Hz),3.65-3.72(1H,m),3.69(1H,s),3.96-4.12(3H,m),4.44(1H,d,J=7.5Hz),4.51,4.53 (total 1H,each s),4.93(1H,d,J=5Hz),5.17-5.22(1H,m)</p>



【0084】

【表30】

参考例	R <sup>3</sup>	性状及び物性
9	i-Pent	<p>無色固体</p> <p>NMR スペクトル <math>\delta</math> (CDCl<sub>3</sub>)ppm:0.84(3H,t,J=7.5Hz),0.93(6H,d,J=6Hz),1.00-1.80(34H,m),1.02(3H,d,J=6.5Hz),1.07(3H,t,J=7Hz),1.86-2.04(2H,m),2.18(1H,d,J=10.5Hz),2.23(3H,s),2.30-2.41(1H,m),2.36(1H,d,J=15.5Hz),2.44-2.52(1H,m),2.55-2.68(2H,m),2.86-2.94(1H,m),3.02(1H,t,J=9.5Hz),3.11(1H,s),3.22(1H,d,d,J=10.7Hz),3.32(3H,s),3.45-3.63(2H,m),3.59(1H,d,J=7.5Hz),3.64-3.72(1H,m),3.68(1H,s),3.99-4.07(4H,m),4.44(1H,d,J=7.5Hz),4.45(1H,s),4.93(1H,d,J=5Hz),5.11(1H,dd,J=11.2Hz)</p>
10		<p>褐色固体</p> <p>NMR スペクトル <math>\delta</math> (CDCl<sub>3</sub>)ppm:0.80-0.96(6H,m),0.92(3H,t,J=7.5Hz),0.96-1.80(35H,m),1.00(3H,d,J=6.5Hz),1.07(3H,t,J=7Hz),1.85-2.04(2H,m),2.20(1H,d,J=10.5Hz),2.24(3H,s),2.33-2.42(1H,m),2.37(1H,d,J=15.5Hz),2.44-2.52(1H,m),2.55-2.70(2H,m),2.87-2.95(1H,m),3.02(1H,t,J=10Hz),3.13(1H,s),3.23(1H,dd,J=10.5,7.5Hz),3.32(3H,s),3.45-3.63(2H,m),3.58(1H,d,J=7.5Hz),3.68-3.76(1H,m),3.69(1H,s),3.88-3.95(1H,m),4.00-4.18(2H,m),4.44(1H,d,J=7.5Hz),4.52(1H,s),4.93(1H,d,J=4.5Hz),5.11(1H,dd,J=11.5,2Hz)</p>
11	n-Hex	<p>淡褐色固体</p> <p>NMR スペクトル <math>\delta</math> (CDCl<sub>3</sub>)ppm:0.84(3H,t,J=7.5Hz),0.89(3H,t,J=6.5Hz),0.95-1.80(39H,m),1.02(3H,d,J=6.5Hz),1.07(3H,t,J=7Hz),1.88-2.05(2H,m),2.18(1H,d,J=10Hz),2.23(3H,s),2.31-2.42(1H,m),2.37(1H,d,J=16Hz),2.45-2.53(1H,m),2.55-2.68(2H,m),2.87-2.95(1H,m),3.02(1H,t,J=10Hz),3.11(1H,s),3.22(1H,dd,J=10.7,7.5Hz),3.32(3H,s),3.44-3.52(1H,m),3.55-3.61(1H,m),3.59(1H,d,J=7.5Hz),3.63-3.73(1H,m),3.68(1H,s),3.95-4.08(4H,m),4.44(1H,d,J=7.5Hz),4.46(1H,s),4.92(1H,d,J=5Hz),5.11(1H,dd,J=11.2Hz)</p>
12		<p>無色固体</p> <p>NMR スペクトル <math>\delta</math> (CDCl<sub>3</sub>)ppm:0.84(3H,t,J=7.5Hz),0.90(3H,t,J=7.5Hz),0.90(3H,t,J=7.5Hz),1.00-1.80(36H,m),1.02(3H,d,J=6.5Hz),1.07(3H,t,J=7.5Hz),1.88-2.04(2H,m),2.18(1H,d,J=10.5Hz),2.23(3H,s),2.32-2.42(1H,m),2.37(1H,d,J=16Hz),2.44-2.52(1H,m),2.55-2.68(2H,m),2.86-2.95(1H,m),3.02(1H,t,J=10Hz),3.11(1H,s),3.22(1H,dd,J=10.7,7.5Hz),3.32(3H,s),3.44-3.62(2H,m),3.59(1H,d,J=7.5Hz),3.65-3.72(1H,m),3.69(1H,s),3.89-3.98(2H,m),3.99-4.07(1H,m),4.05(1H,d,J=11Hz),4.44(1H,d,J=7.5Hz),4.47(1H,s),4.92(1H,d,J=5Hz),5.12(1H,dd,J=11.2Hz)</p>





【0085】

【表31】

参考例	R <sup>3</sup>	性状及び物性
13	n-Oct	<p>淡褐色固体</p> <p>NMR スペクトル <math>\delta</math> (CDCl<sub>3</sub>)ppm:0.84(3H,t,J=7.5Hz),0.88(3H,t,J=6.5Hz),0.97-1.80(43H,m),1.02(3H,d,J=7.5Hz),1.07(3H,t,J=7 Hz),1.86-1.96(1H,m),1.96-2.03(1H,m),2.18(1H,d,J=10.5Hz),2.23(3H,s),2.31-2.41(1H,m),2.37(1H,d,J=15.5Hz),2.43-2.51(1H,m),2.55-2.68(2H,m),2.86-2.95(1H,m),3.03(1H,t,J=10Hz),3.11(1H,s),3.22(1H,dd,J=10.7,5Hz),3.32(3H,s),3.44-3.52(1H,m),3.59(1H,d,J=7.5Hz),3.60(1H,bs),3.65-3.72(1H,m),3.68(1H,s),3.95-4.07(1H,m),4.00(2H,t,J=6.5Hz),4.05(1H,d,J=10Hz),4.44(1H,d,J=7.5Hz),4.47(1H,s),4.93(1H,d,J=5Hz),5.11(1H,dd,J=11,2Hz)</p>
14	n-Dodec	<p>淡褐色固体</p> <p>NMR スペクトル <math>\delta</math> (CDCl<sub>3</sub>)ppm:0.84(3H,t,J=7.5Hz),0.88(3H,t,J=7Hz),1.00-1.70(50H,m),1.02(3H,d,J=7.5Hz),1.07(3H,t,J=7 Hz),1.76(1H,bs),1.86-2.04(2H,m),2.18(1H,d,J=10.5Hz),2.23(3H,s),2.30-2.41(1H,m),2.36(1H,d,J=10.5Hz),2.42-2.52(1H,m),2.55-2.68(2H,m),2.87-2.95(1H,m),3.02(1H,t,J=10Hz),3.11(1H,s),3.22(1H,dd,J=10.7,5Hz),3.32(3H,s),3.43-3.52(1H,m),3.59(1H,d,J=7.5Hz),3.60(1H,s),3.62-3.72(1H,m),3.68(1H,s),3.95-4.08(3H,m),4.05(1H,d,J=10Hz),4.44(1H,d,J=7.5Hz),4.46(1H,s),4.92(1H,d,J=5Hz),5.11(1H,dd,J=11,2Hz)</p>
15		<p>淡褐色固体</p> <p>NMR スペクトル <math>\delta</math> (CDCl<sub>3</sub>)ppm:0.84(3H,t,J=7.5Hz),0.98-2.04(37H,m),1.03(3H,d,J=7.5Hz),1.07(3H,t,J=7Hz),1.46(9H,s),2.18(1H,d,J=10.5Hz),2.23(3H,s),2.33-2.42(1H,m),2.37(1H,d,J=14.5 Hz),2.45-2.52(1H,m),2.55-2.72(2H,m),2.86-2.95(1H,m),3.02(1H,t,J=10Hz),3.07(1H,s),3.11-3.26(3H,m),3.32(3H,s),3.42-3.78(4H,m),3.58(1H,d,J=7.5Hz),3.60(1H,s),3.70(1H,s),3.97-4.09(1H,m),4.04(1H,d,J=9Hz),4.15-4.23(1H,m),4.35(1H,s),4.44(1H,d,J=7.5Hz),4.92(1H,d,J=5Hz),5.10(1H,dd,J=11,2Hz)</p>
16		<p>淡褐色固体</p> <p>NMR スペクトル <math>\delta</math> (CDCl<sub>3</sub>)ppm:0.84(3H,t,J=7.5Hz),0.96-2.15(39H,m),1.02(3H,d,J=6.5Hz),1.07(3H,t,J=7.5Hz),2.20(1H,d,J=10.5Hz),2.23(3H,s),2.32-2.43(1H,m),2.37(1H,d,J=16Hz),2.45-2.53(1H,m),2.55-2.73(3H,m),2.85-2.97(1H,m),3.02(1H,t,J=10 Hz),3.11(1H,s),3.22(1H,dd,J=10.5,7.5Hz),3.32(3H,s),3.43-3.75(3H,m),3.58(1H,d,J=7.5Hz),3.68(1H,s),3.94-4.10(1H,m),3.99(2H,d,J=6.5Hz),4.05(1H,d,J=10Hz),4.40-4.48(1H,m),4.44(1H,s),4.93(1H,d,J=5Hz),5.11(1H,dd,J=11,2Hz)</p>





【0086】

【表32】

参考例	R <sup>2</sup>	性状及び物性
17		無色固体 NMR スペクトル $\delta$ (CDCl <sub>3</sub> )ppm:0.84(3H,t,J=7.5Hz),0.97-1.85(39H,m),1.02(3H,d,J=7.5Hz),1.07(3H,t,J=7.5Hz),1.87-2.05(2H,m),2.14-2.28(1H,m),2.19(1H,d,J=10.5Hz),2.24(3H,s),2.32-2.43(1H,m),2.36(1H,d,J=15.5Hz),2.45-2.53(1H,m),2.55-2.71(2H,m),2.87-2.96(1H,m),3.02(1H,t,J=10Hz),3.11(1H,s),3.22(1H,dd,J=10.5,7.5Hz),3.32(3H,s),3.43-3.62(2H,m),3.59(1H,d,J=7.5Hz),3.64-3.75(1H,m),3.68(1H,s),3.84-3.95(2H,m),3.98-4.09(1H,m),4.05(1H,d,J=10Hz),4.44(1H,d,J=7.5Hz),4.46(1H,s),4.93(1H,d,J=5Hz),5.12(1H,dd,J=11.2Hz)
18		淡褐色固体 NMR スペクトル $\delta$ (CDCl <sub>3</sub> )ppm:0.84(3H,t,J=7.5Hz),0.90-1.75(48H,m),1.76-2.03(2H,m),2.20(1H,d,J=10.5Hz),2.23(3H,s),2.31-2.42(1H,m),2.36(1H,d,J=14.5Hz),2.43-2.52(1H,m),2.55-2.68(2H,m),2.86-2.95(1H,m),3.02(1H,t,J=10Hz),3.11(1H,s),3.22(1H,dd,J=10.5,7.5Hz),3.32(3H,s),3.44-3.52(1H,m),3.59(1H,d,J=7.5Hz),3.60-3.75(2H,m),3.68(1H,s),3.77-3.86(2H,m),3.96-4.07(2H,m),4.44(1H,d,J=7.5Hz),4.47(1H,s),4.93(1H,d,J=4.5Hz),5.11(1H,dd,J=11.2Hz)
19		無色無晶形固体 NMR スペクトル $\delta$ (CDCl <sub>3</sub> )ppm:0.80-1.80(50H,m),0.84(3H,t,J=7.5Hz),1.88-2.05(2H,m),2.17(1H,d,J=10.5Hz),2.23(3H,s),2.30-2.42(1H,m),2.36(1H,d,J=15.5Hz),2.45-2.53(1H,m),2.55-2.70(2H,m),2.88-2.98(1H,m),3.02(1H,t,J=10Hz),3.11(1H,s),3.22(1H,dd,J=10.5,7.5Hz),3.32(3H,s),3.43-3.54(1H,m),3.59(1H,d,J=7.5Hz),3.60(1H,brs),3.62-3.72(1H,m),3.68(1H,s),4.00-4.10(4H,m),4.44(1H,d,J=7.5Hz),4.46(1H,s),4.92(1H,d,J=5Hz),5.12(1H,d,J=11.2Hz)
20		無色固体 NMR スペクトル $\delta$ (CDCl <sub>3</sub> )ppm:0.80-1.80(46H,m),0.84(3H,t,J=7.5Hz),1.02(3H,d,J=6.5Hz),1.07(3H,t,J=7Hz),1.86-2.05(2H,m),2.18(1H,d,J=10.5Hz),2.23(3H,s),2.32-2.42(1H,m),2.37(1H,d,J=15.5Hz),2.44-2.54(1H,m),2.55-2.70(2H,m),2.86-2.97(1H,m),3.02(1H,t,J=10Hz),3.11(1H,s),3.22(1H,dd,J=10.5,7.5Hz),3.32(3H,s),3.44-3.75(3H,m),3.68(1H,s),3.71(1H,s),3.91-4.10(4H,m),4.44(1H,d,J=7.5Hz),4.46(1H,s),4.92(1H,d,J=4.5Hz),5.12(1H,dd,J=11.2Hz)





[0087]

[表33]

参考例	R <sup>3</sup>	性状及び物性
21		淡褐色固体 NMR スペクトル $\delta$ (CDCl <sub>3</sub> )ppm:0.85(3H,t,J=7.5Hz),0.99(3H,d,J=6.5Hz),1.02-1.75(34H,m),1.87-2.03(2H,m),2.18(1H,d,J=10.5Hz),2.23(3H,s),2.32-2.42(1H,m),2.37(1H,d,J=16Hz),2.43-2.52(1H,m),2.55-2.70(2H,m),2.86-2.96(1H,m),3.03(1H,t,J=10Hz),3.11(1H,s),3.21(1H,dd,J=10.5,7.5Hz),3.32(3H,s),3.40-3.55(1H,m),3.54(1H,d,J=7.5Hz),3.59(1H,s),3.65-3.78(1H,m),3.70(1H,s),3.93-4.07(1H,m),4.00(1H,d,J=10Hz),4.39(1H,s),4.41(1H,d,J=6.5Hz),4.92(1H,d,J=5Hz),5.04(1H,d,J=2Hz),5.07(1H,d,J=2Hz),5.12(1H,dd,J=11.5,2Hz),7.20-7.45(5H,m)
22		無色固体 NMR スペクトル $\delta$ (CDCl <sub>3</sub> )ppm:0.85(3H,t,J=7.5Hz),0.98(3H,d,J=6.5Hz),1.02-1.80(34H,m),1.86-2.02(2H,m),2.19(1H,d,J=10.5Hz),2.23(3H,s),2.31-2.42(1H,m),2.37(1H,d,J=15.5Hz),2.43-2.52(1H,m),2.55-2.69(2H,m),2.86-3.00(3H,m),3.03(1H,t,J=10Hz),3.13(1H,s),3.20(1H,dd,J=10.5,7.5Hz),3.32(3H,s),3.40-3.68(2H,m),3.50(1H,d,J=8Hz),3.57(1H,s),3.71(1H,s),3.93-4.08(1H,m),4.02(1H,d,J=10.5Hz),4.27(2H,t,J=6.5Hz),4.41(1H,d,J=7.5Hz),4.47(1H,s),4.94(1H,d,J=5Hz),5.13(1H,dd,J=11.2Hz),7.12-7.38(5H,m)
23		無色固体 NMR スペクトル $\delta$ (CDCl <sub>3</sub> )ppm:0.85(3H,t,J=7.5Hz),0.98-1.80(30H,m),1.04(3H,d,J=6.5Hz),1.07(3H,t,J=7.5Hz),1.80(1H,brs),1.87-2.05(4H,m),2.18(1H,d,J=10.5Hz),2.23(3H,s),2.30-2.42(1H,m),2.36(1H,d,J=15.5Hz),2.45-2.53(1H,m),2.56-2.75(4H,m),2.87-2.95(1H,m),3.02(1H,t,J=10Hz),3.10(1H,s),3.22(1H,dd,J=10.7,7.5Hz),3.32(3H,s),3.42-3.76(3H,m),3.59(1H,d,J=7.5Hz),3.69(1H,s),3.94-4.10(4H,m),4.41(1H,s),4.44(1H,d,J=7.5Hz),4.92(1H,d,J=5Hz),5.11(1H,dd,J=11.2,5Hz),7.15-7.22(3H,m),7.24-7.32(2H,m)
24		無色固体 NMR スペクトル $\delta$ (CDCl <sub>3</sub> )ppm:0.84(3H,t,J=7.5Hz),0.95-1.83(36H,m),1.02(3H,d,J=7.5Hz),1.07(3H,t,J=7.5Hz),1.87-2.05(2H,m),2.18(1H,d,J=10.5Hz),2.24(3H,s),2.31-2.71(6H,m),2.36(1H,d,J=15.5Hz),2.87-2.95(1H,m),3.03(1H,t,J=10Hz),3.10(1H,s),3.22(1H,dd,J=10.7,7.5Hz),3.32(3H,s),3.45-3.56(1H,m),3.58(1H,d,J=7.5Hz),3.59(1H,s),3.63-3.73(1H,m),3.68(1H,s),3.95-4.10(4H,m),4.42(1H,s),4.44(1H,d,J=6.5Hz),4.92(1H,d,J=5Hz),5.11(1H,d,J=11.2Hz),7.10-7.35(4H,m)




【0088】

【表34】

参考例	R <sup>3</sup>	性状及び物性
25		無色固体 NMR スペクトル $\delta$ (CDCl <sub>3</sub> )ppm:0.84(3H,t,J=7.5Hz),0.95-1.82(36H,m),1.01(3H,d,J=6.5Hz),1.07(3H,t,J=7.5Hz),1.76(1H,brs),1.87-2.05(2H,m),2.18(1H,d,J=10.5Hz),2.23(3H,s),2.31-2.42(1H,m),2.36(1H,d,J=14.5Hz),2.44-2.53(1H,m),2.55-2.70(4H,m),2.86-2.95(1H,m),3.02(1H,t,J=10Hz),3.10(1H,s),3.22(1H,dd,J=10.5,7.5Hz),3.32(3H,s),3.43-3.53(1H,m),3.59(1H,d,J=7.5Hz),3.60(1H,s),3.62-3.72(1H,m),3.68(1H,s),3.93-4.10(4H,m),4.40-4.48(1H,m),4.44(1H,s),4.91(1H,d,J=5Hz),5.11(1H,dd,J=10.5,2Hz),7.10-7.35(5H,m)
26		無色固体 NMR スペクトル $\delta$ (CDCl <sub>3</sub> )ppm:0.84(3H,t,J=7.5Hz),1.01(3H,d,J=6.5Hz),1.06(3H,t,J=7Hz),1.09(3H,d,J=7.5Hz),1.05-1.67(2H,m),1.87-2.01(2H,m),1.94(1H,s),2.17(1H,d,J=10.5Hz),2.23(3H,s),2.30-2.41(1H,m),2.34(1H,d,J=14.5Hz),2.42-2.50(1H,m),2.52-2.62(1H,m),2.63-2.71(1H,m),2.82-2.91(1H,m),3.00(1H,t,J=10Hz),3.08(1H,s),3.21(1H,dd,J=10,7.5Hz),3.30(3H,s),3.42-3.50(1H,m),3.52(1H,d,J=8Hz),3.55(1H,brs),3.68-3.77(1H,m),3.76(1H,s),3.89-4.00(1H,m),3.92(1H,d,J=9Hz),4.09-4.20(2H,m),4.32-4.40(4H,m),4.78(1H,d,J=5Hz),5.10(1H,dd,J=11,2Hz),6.89-6.96(3H,m),7.22-7.30(2H,m)
27		無色固体 NMR スペクトル $\delta$ (CDCl <sub>3</sub> )ppm:0.85(3H,t,J=7.5Hz),0.95-1.69(30H,m),1.02(3H,d,J=6.5Hz),1.07(3H,t,J=7.5Hz),1.72(1H,brs),1.87-2.04(2H,m),2.06-2.26(2H,m),2.17(1H,d,J=10.5Hz),2.23(3H,s),2.32-2.42(1H,m),2.36(1H,d,J=16Hz),2.44-2.53(1H,m),2.55-2.70(2H,m),2.86-2.95(1H,m),3.02(1H,t,J=10Hz),3.10(1H,s),3.22(1H,dd,J=10.7Hz),3.32(3H,s),3.43-3.62(2H,m),3.57(1H,d,J=7.5Hz),3.65-3.75(1H,m),3.70(1H,s),3.95-4.10(4H,m),4.15-4.26(2H,m),4.38(1H,s),4.43(1H,d,J=7.5Hz),4.92(1H,d,J=5Hz),5.11(1H,dd,J=11,2Hz),6.88-6.96(3H,m),7.24-7.30(2H,m)
28		淡褐色固体 NMR スペクトル $\delta$ (CDCl <sub>3</sub> )ppm:0.85(3H,t,J=7.5Hz),1.02(3H,d,J=7.5Hz),1.07(3H,t,J=7.5Hz),1.00-2.03(37H,m),2.17(1H,d,J=10Hz),2.23(3H,s),2.31-2.41(1H,m),2.36(1H,d,J=15.5Hz),2.43-2.51(1H,m),2.54-2.70(2H,m),2.85-2.95(1H,m),3.02(1H,t,J=10Hz),3.10(1H,s),3.22(1H,dd,J=10.5,7.5Hz),3.32(3H,s),3.43-3.51(1H,m),3.58(1H,d,J=7.5Hz),3.59(1H,s),3.65-3.72(1H,m),3.69(1H,s),3.95-4.10(6H,m),4.41(1H,s),4.44(1H,d,J=7.5Hz),4.91(1H,d,J=5Hz),5.11(1H,dd,J=11,2Hz),6.86-6.95(3H,m),7.21-7.29(2H,m)

【0089】

【表35】

参考例	R <sup>2</sup>	性状及び物性
29		無色固体 NMR スペクトル $\delta$ (CDCl <sub>3</sub> )ppm:0.85(3H,t,J=7.5Hz),1.02(3H,d,J=7.5Hz),1.07(3H,t,J=7Hz),0.95-1.75(30H,m),1.86-2.03(2H,m),1.92(1H,brs),2.18(1H,d,J=10.5Hz),2.23(3H,s),2.32-2.42(1H,m),2.36(1H,d,J=14.5Hz),2.43-2.52(1H,m),2.54-2.72(2H,m),2.87-2.95(1H,m),3.01(1H,t,J=10Hz),3.08(1H,s),3.10-3.20(2H,m),3.22(1H,dd,J=10.5,7.5Hz),3.32(3H,s),3.43-3.53(1H,m),3.58(1H,d,J=7.5Hz),3.59(1H,s),3.65-3.73(1H,m),3.72(1H,s),3.98-4.06(1H,m),4.04(1H,d,J=9Hz),4.11-4.22(2H,m),4.25(1H,m),4.43(1H,d,J=7.5Hz),4.89(1H,d,J=5Hz),5.11(1H,dd,J=11.2Hz),7.17-7.41(5H,m)
30		淡褐色固体 NMR スペクトル $\delta$ (CDCl <sub>3</sub> )ppm:0.85(3H,t,J=7.5Hz),0.95-1.68(31H,m),1.00(3H,d,J=7.5Hz),1.07(3H,t,J=7.5Hz),1.87-2.00(2H,m),2.18(1H,d,J=10.5Hz),2.23(3H,s),2.32-2.41(1H,m),2.37(1H,d,J=15.5Hz),2.42-2.52(1H,m),2.53-2.68(2H,m),2.88-2.96(1H,m),3.03(1H,t,J=10Hz),3.10-3.23(3H,m),3.11(1H,s),3.32(3H,s),3.43-3.52(1H,m),3.51(1H,d,J=7.5Hz),3.59(1H,brs),3.60-3.70(1H,m),3.71(1H,s),3.96-4.04(1H,m),4.03(1H,d,J=9Hz),4.28(2H,t,J=8.5Hz),4.41(1H,d,J=6.5Hz),4.42(1H,s),4.93(1H,d,J=5Hz),5.12(1H,dd,J=11.5,2.5Hz),6.85(1H,d,J=3.5Hz),6.95(1H,dd,J=5,3.5Hz),7.15(1H,d,J=5Hz)
31		無色固体 NMR スペクトル $\delta$ (CDCl <sub>3</sub> )ppm:0.85(3H,t,J=7.5Hz),0.97(3H,d,J=6.5Hz),1.00-1.68(30H,m),1.07(3H,t,J=7Hz),1.81-2.03(2H,m),1.87(1H,brs),2.18(1H,d,J=10.5Hz),2.23(3H,s),2.31-2.41(1H,m),2.36(1H,d,J=15.5Hz),2.42-2.52(1H,m),2.53-2.70(2H,m),2.88-2.95(1H,m),2.95(3H,s),3.02(1H,t,J=10Hz),3.09(1H,s),3.21(1H,dd,J=10.5,7.5Hz),3.32(3H,s),3.42-3.51(1H,m),3.51-3.69(5H,m),3.71(1H,s),3.97-4.05(1H,m),4.03(1H,d,J=8.5Hz),4.20(2H,t,J=6Hz),4.35(1H,s),4.42(1H,d,J=6.5Hz),4.91(1H,d,J=5Hz),5.12(1H,dd,J=11.2Hz),6.71(1H,t,J=7Hz),6.75(2H,d,J=8.5Hz),7.20-7.38(2H,m)

## 【0090】参考例32

3'-N-デメチル-5-O-デソサミニル-3'-N-エチルエリスロライドA 9-[O-[3-(4-ピリジル)プロピル]オキシム]  
1mol/塩酸70ml中に室温攪拌下、3'-N-デメチル-3'-N-エチルエリスロマイシンA 9-[O-[3-(4-ピリジル)プロピル]オキシム] 7.00gを加え、室温で2.5時間攪拌した。反応後、水水中へ反応液を注ぎ、2mol/L水酸化ナトリウム水溶液でアルカリ性にした後、析出した固体を採取し、水洗して無色固体3.50gを得た。

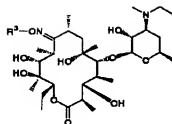
NMRスペクトル  $\delta$  (CDCl<sub>3</sub>)ppm:0.85(3H,t,J=7.5Hz),1.00-1.73(30H,m),1.87-2.13(4H,m),2.21(3H,s),2.30-2.42(2H,m),2.50-2.75(6H,m),3.15(1H,brs),3.26(1H,d,J=10.7,5Hz),3.45-3.77(3H,m),3.51(1H,d,J=2Hz),3.60(1H,d,J=10.5Hz),3.68(1H,s),3.97-4.12(2H,m),4.29(1H,s),4.39(1H,d,J=7.5Hz),5.22(1H,dd,J=11.2Hz),7.12(2H,d,J=6Hz),8.51(2H,d,J=6Hz)

【0091】参考例32と同様にして、参考例33〜参考例62の化合物を得た。

【0092】

【表36】





参考例	R <sup>3</sup>	性状及び物性
33	Me	無色無晶形固体 NMR スペクトル $\delta$ (CDCl <sub>3</sub> )ppm:0.85(3H,t,J=7.5Hz),1.05(3H,t,J=7Hz),1.06(3H,d,J=6.5Hz),1.09(3H,d,J=7.5Hz),1.14-1.75(20H,m),1.87-2.00(1H,m),2.03-2.10(1H,m),2.20(3H,s),2.30-2.40(1H,m),2.35(1H,s),2.50-2.74(4H,m),3.17(1H,s),3.25(1H,dd,J=10.5,7.5Hz),3.48-3.64(4H,m),3.66-3.76(1H,m),3.67(1H,s),3.84(3H,s),3.92(1H,brs),4.35(1H,s),4.39(1H,d,J=7.5Hz),5.23(1H,dd,J=11.2Hz)
34	Et	無色無晶形固体 NMR スペクトル $\delta$ (CDCl <sub>3</sub> )ppm:0.85(3H,t,J=7.5Hz),0.98-1.75(32H,m),1.88-2.00(1H,m),2.05-2.14(1H,m),2.20(3H,s),2.30-2.41(1H,m),2.34(1H,s),2.50-2.62(4H,m),3.18(1H,s),3.25(1H,dd,J=10.5,7.5Hz),3.47-3.77(3H,m),3.52(1H,d,J=2Hz),3.59(1H,s),3.68(1H,s),3.92(1H,brs),4.00-4.16(2H,m),4.39(1H,d,J=7.5Hz),4.43(1H,s),5.23(1H,dd,J=11.25Hz)
35	n-Pr	無色無晶形固体 NMR スペクトル $\delta$ (CDCl <sub>3</sub> )ppm:0.85(3H,t,J=7.5Hz),0.94(3H,d,J=7.5Hz),0.98-1.73(31H,m),1.88-2.00(1H,m),2.05-2.15(1H,m),2.20(3H,s),2.28-2.40(1H,m),2.31(1H,s),2.50-2.73(4H,m),3.18(1H,s),3.25(1H,dd,J=10.75Hz),3.47-3.78(3H,m),3.52(1H,d,J=2Hz),3.60(1H,d,J=5.5Hz),3.68(1H,s),3.87-4.06(3H,m),4.39(1H,d,J=7.5Hz),4.43(1H,s),5.23(1H,dd,J=11.52Hz)



【0093】

【表37】

参考例	R <sup>3</sup>	性状及び物性
36	i-Pr	<p>無色無晶形固体</p> <p>NMR スペクトル <math>\delta</math> (CDCl<sub>3</sub>)ppm:0.85(3H,t,J=7.5Hz),1.00-1.07(6H,m),1.10(3H,d,J=7.5Hz),1.15-1.70(26H,m),1.89-1.99(1H,m),2.08-2.15(1H,m),2.20(3H,s),2.30-2.40(1H,m),2.32(1H,s),2.50-2.70(4H,m),3.18(1H,s),3.25(1H,dd,J=10,7.5Hz),3.45-3.73(2H,m),3.52(1H,d,J=2Hz),3.54,3.55(total 1H,each s),3.59(1H,d,J=11Hz),3.69(1H,s),3.91(1H,brs),4.23-4.32(1H,m),4.39(1H,d,J=7.5Hz),4.48(1H,s),5.24(1H,dd,J=11,2.5Hz)</p>
37	n-Bu	<p>淡黄色無晶形固体</p> <p>NMR スペクトル <math>\delta</math> (CDCl<sub>3</sub>)ppm:0.85(3H,t,J=7.5Hz),0.94(3H,t,J=7.5Hz),1.00-1.78(29H,m),1.83-2.00(3H,m),2.07-2.13(1H,m),2.20(3H,s),2.30-2.42(1H,m),2.31(1H,s),2.48-2.72(4H,m),3.18(1H,s),3.25(1H,dd,J=10.5,7.5Hz),3.50-3.80(5H,m),3.52(1H,d,J=2.5Hz),3.59(1H,s),3.68(1H,s),3.82-4.08(2H,m),3.92(1H,brs),4.39(1H,d,J=7.5Hz),4.43(1H,s),5.23(1H,dd,J=11.5,2Hz)</p>
38	i-Bu	<p>無色無晶形固体</p> <p>NMR スペクトル <math>\delta</math> (CDCl<sub>3</sub>)ppm:0.85(3H,t,J=7.5Hz),0.93(3H,d,J=6.5Hz),0.93(3H,d,J=6.5Hz),0.98-1.80(29H,m),1.88-2.00(2H,m),2.05-2.15(1H,m),2.20(3H,s),2.28(1H,s),2.30-2.42(1H,m),2.50-2.73(4H,m),3.17(1H,s),3.25(1H,dd,J=10,7.5Hz),3.45-4.00(6H,m),3.58(1H,s),3.68(1H,s),3.93(1H,brs),4.39(1H,d,J=7.5Hz),4.43(1H,s),5.23(1H,dd,J=11,2Hz)</p>
39	sec-Bu	<p>無色無晶形固体</p> <p>NMR スペクトル <math>\delta</math> (CDCl<sub>3</sub>)ppm:0.85(3H,t,J=7.5Hz),0.90,0.93(total 3H,each t,J=7.5Hz),1.00-1.70(35H,m),1.89-1.99(1H,m),2.06-2.15(1H,m),2.20(3H,s),2.26,2.31(total 1H,each s),2.30-2.40(1H,m),2.50-2.71(4H,m),3.18(1H,brs),3.25(1H,dd,J=10.5,7.5Hz),3.48-3.62(3H,m),3.59(1H,d,J=11Hz),3.66-3.75(1H,m),3.69(1H,s),4.03-4.15(1H,m),4.40(1H,d,J=7.5Hz),4.48,4.49(total 1H,each s),5.23(1H,dd,J=11,2.5Hz)</p>

[0094]

[表38]

参考例	R <sup>3</sup>	性状及び物性
40	i-Pent	無色無晶形固体 NMR スペクトル $\delta$ (CDCl <sub>3</sub> )ppm:0.85(3H,t,J=7.5Hz),0.93(6H,d,J=6.5Hz),1.00-1.72(32H,m),1.89-1.99(1H,m),2.05-2.13(1H,m),2.20(3H,s),2.27-2.40(1H,m),2.30(1H,s),2.50-2.71(4H,m),3.17(1H,s),3.25(1H,dd,J=10,7.5Hz),3.50-3.62(2H,m),3.52(1H,d,J=2Hz),3.58(1H,s),3.65-3.73(1H,m),3.68(1H,s),3.92(1H,brs),4.06(2H,t,J=6.5Hz),4.39(1H,d,J=7.5Hz),4.41(1H,s),5.23(1H,dd,J=11.2,5Hz)
41		淡褐色無晶形固体 NMR スペクトル $\delta$ (CDCl <sub>3</sub> )ppm:0.81-0.94(6H,m),0.84(3H,t,J=7.5Hz),1.00-1.70(33H,m),1.88-1.98(1H,m),2.08-2.15(1H,m),2.20(3H,s),2.25(1H,s),2.30-2.39(1H,m),2.50-2.71(4H,m),3.15(1H,s),3.25(1H,dd,J=10.5,7.5Hz),3.45-3.62(4H,m),3.67-3.78(1H,m),3.69(1H,s),3.85-3.98(2H,m),4.40(1H,d,J=7.5Hz),4.48(1H,s),5.23(1H,dd,J=11.2Hz)
42	n-Hex	淡褐色無晶形固体 NMR スペクトル $\delta$ (CDCl <sub>3</sub> )ppm:0.85(3H,t,J=7.5Hz),0.90(3H,d,J=6.5Hz),1.00-1.75(37H,m),1.88-1.99(1H,m),2.05-2.13(1H,m),2.20(3H,s),2.28-2.39(1H,m),2.32(1H,s),2.50-2.70(4H,m),3.18(1H,s),3.25(1H,dd,J=10.5,7.5Hz),3.49-3.62(2H,m),3.52(1H,d,J=1Hz),3.60(1H,s),3.65-3.75(1H,m),3.68(1H,s),3.85-4.05(3H,m),4.39(1H,d,J=7.5Hz),4.43(1H,s),5.23(1H,dd,J=11.5,2Hz)
43		無色無晶形固体 NMR スペクトル $\delta$ (CDCl <sub>3</sub> )ppm:0.85(3H,t,J=7.5Hz),0.90(3H,t,J=7.5Hz),0.90(3H,t,J=7.5Hz),1.00-1.75(34H,m),1.88-1.98(1H,m),2.06-2.14(1H,m),2.22(3H,s),2.24(1H,s),2.30-2.40(1H,m),2.49-2.70(4H,m),3.18(1H,s),3.25(1H,dd,J=10.5,7.5Hz),3.49-3.62(2H,m),3.52(1H,d,J=2Hz),3.59(1H,s),3.65-3.73(1H,m),3.68(1H,s),3.88-3.99(3H,m),4.39(1H,d,J=7.5Hz),4.44(1H,s),5.23(1H,dd,J=11.2,5Hz)



【0095】

【表39】

参考例	R <sup>3</sup>	性状及び物性
44	n-Oct	<p>淡褐色無晶形固体</p> <p>NMR スペクトル <math>\delta</math> (CDCl<sub>3</sub>)ppm:0.85(3H,t,J=7.5Hz),0.89(3H,t,J=6.5Hz),1.00-1.70(38H,m),1.10(3H,d,J=7.5Hz),1.88-1.99(1H,m),2.05-2.14(1H,m),2.20(3H,s),2.28-2.40(1H,m),2.31(1H,s),2.50-2.70(4H,m),3.18(1H,s),3.25(1H,dd,J=10.7,5Hz),3.49-3.62(3H,m),3.52(1H,d,J=2Hz),3.66-3.75(1H,m),3.68(1H,s),3.93(1H,brs),3.98-4.06(2H,m),4.39(1H,d,J=7.5Hz),4.43(1H,s),5.23(1H,dd,J=11.5,2Hz)</p>
45	n-Dodec	<p>淡褐色無晶形固体</p> <p>NMR スペクトル <math>\delta</math> (CDCl<sub>3</sub>)ppm:0.85(3H,t,J=7.5Hz),0.88(3H,t,J=7Hz),0.95-1.70(49H,m),1.89-1.98(1H,m),2.06-2.13(1H,m),2.20(3H,s),2.29-2.39(1H,m),2.31(1H,s),2.49-2.70(4H,m),3.18(1H,s),3.25(1H,dd,J=10.5,7.5Hz),3.48-3.56(2H,m),3.56-3.61(2H,m),3.67-3.75(1H,m),3.68(1H,s),3.93(1H,brs),3.98-4.05(2H,m),4.39(1H,d,J=7.5Hz),4.43(1H,s),5.23(1H,dd,J=11.2Hz)</p>
46		<p>淡黄色無晶形固体</p> <p>NMR スペクトル <math>\delta</math> (CDCl<sub>3</sub>)ppm:0.85(3H,t,J=7.5Hz),0.95-2.00(35H,m),1.46(9H,s),2.05-2.13(1H,m),2.20(3H,s),2.23(1H,s),2.30-2.42(1H,m),2.48-2.75(4H,m),3.10-3.29(2H,m),3.13(1H,s),3.25(1H,dd,J=10.7,5Hz),3.43-3.80(6H,m),3.58(1H,s),3.69(1H,s),4.15-4.28(1H,m),4.32(1H,s),4.39(1H,d,J=7.5Hz),5.22(1H,dd,J=11.2,5Hz)</p>
47		<p>無色無晶形固体</p> <p>NMR スペクトル <math>\delta</math> (CDCl<sub>3</sub>)ppm:0.85(3H,t,J=7.5Hz),0.98-2.15(37H,m),2.19(3H,s),2.25(1H,s),2.30-2.40(1H,m),2.48-2.72(5H,m),3.17(1H,s),3.25(1H,dd,J=10.5,7.5Hz),3.45-3.76(4H,m),3.51(1H,d,J=2Hz),3.68(1H,s),3.70-4.07(2H,m),3.92(1H,brs),4.39(1H,d,J=7.5Hz),4.41(1H,s),5.23(1H,dd,J=11.2,5Hz)</p>





[0096]

[表40]

参考例	R <sup>2</sup>	性状及び物性
48		無色無晶形固体 NMR スペクトル $\delta$ (CDCl <sub>3</sub> )ppm:0.85(3H,t,J=7.5Hz),0.97-1.81(37H,m),1.88-2.00(1H,m),2.07-2.26(2H,m),2.20(3H,s),2.28(1H,s),2.30-2.41(1H,m),2.49-2.73(4H,m),3.17(1H,s),3.25(1H,dd,J=10.5,7.5Hz),3.45-3.77(3H,m),3.52(1H,d,J=2Hz),3.59(1H,s),3.68(1H,s),3.82-4.00(3H,m),4.39(1H,d,J=7.5Hz),4.44(1H,s),5.23(1H,dd,J=11,2Hz)
49		無色無晶形固体 NMR スペクトル $\delta$ (CDCl <sub>3</sub> )ppm:0.85(3H,t,J=7.5Hz),0.90-1.82(40H,m),1.88-1.99(1H,m),2.03-2.12(1H,m),2.20(3H,s),2.29(1H,s),2.30-2.39(1H,m),2.50-2.71(4H,m),3.18(1H,s),3.25(1H,dd,J=10,7.5Hz),3.50-4.00(5H,m),3.52(1H,d,J=2.5Hz),3.59(1H,s),3.67(1H,s),3.93(1H,s),4.39(1H,d,J=7.5Hz),4.33(1H,s),5.23(1H,dd,J=11,2Hz)
50		無色無晶形固体 NMR スペクトル $\delta$ (CDCl <sub>3</sub> )ppm:0.80-1.80(42H,m),0.85(3H,t,J=7.5Hz),1.90-2.00(1H,m),2.06-2.13(1H,m),2.20(3H,s),2.25-2.40(1H,m),2.31(1H,s),2.50-2.72(4H,m),3.18(1H,s),3.25(1H,dd,J=10.5,7.5Hz),3.45-3.78(5H,m),3.67(1H,s),3.94(1H,brs),4.06(2H,t,J=7Hz),4.39(1H,d,J=7.5Hz),4.43(1H,s),5.23(1H,dd,J=11.5,2Hz)
51		淡褐色無晶形固体 NMR スペクトル $\delta$ (CDCl <sub>3</sub> )ppm:0.80-1.80(45H,m),0.85(3H,t,J=7.5Hz),1.88-2.00(1H,m),2.05-2.14(1H,m),2.20(3H,s),2.30-2.42(1H,m),2.33(1H,s),2.48-2.73(4H,m),3.18(1H,s),3.25(1H,dd,J=10.5,7.5Hz),3.45-3.77(3H,m),3.52(1H,d,J=1Hz),3.61(1H,s),3.67(1H,s),3.91-4.08(2H,m),4.39(1H,d,J=7.5Hz),4.43(1H,s),5.23(1H,dd,J=11,2.5Hz)




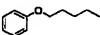
【0097】

【表41】

参考例	R <sup>2</sup>	性状及び物性
52		無色無晶形固体 NMR スペクトル $\delta$ (CDCl <sub>3</sub> )ppm:0.85(3H,t,J=7.5Hz),0.95-1.75(29H,m),1.88-1.99(1H,m),2.03-2.12(1H,m),2.16(1H,s),2.19(3H,s),2.30-2.40(1H,m),2.48-2.73(4H,m),3.16(1H,s),3.24(1H,dd,J=10,7.5Hz),3.45-3.80(4H,m),3.61(1H,s),3.69(1H,s),3.92(1H,brs),4.31(1H,s),4.37(1H,d,J=7.5Hz),5.00-5.10(2H,m),5.23(1H,d,J=11.5Hz),7.20-7.45(5H,m)
53		無色無晶形固体 NMR スペクトル $\delta$ (CDCl <sub>3</sub> )ppm:0.85(3H,t,J=7.5Hz),1.01(3H,d,J=7.5Hz),1.04(3H,t,J=7.5Hz),1.08(3H,d,J=7.5Hz),1.11-1.75(20H,m),1.88-2.00(1H,m),2.02-2.12(1H,m),2.09(1H,s),2.19(3H,s),2.30-2.40(1H,m),2.48-2.71(4H,m),2.90-3.01(2H,m),3.18(1H,s),3.24(1H,dd,J=10,7Hz),3.46(1H,d,J=2Hz),3.48-3.70(3H,m),3.59(1H,s),3.68(1H,s),3.92(1H,brs),4.18-4.32(2H,m),4.37(1H,d,J=7.5Hz),4.38(1H,s),5.23(1H,dd,J=11.2,5Hz),7.11-7.35(5H,m)
54		無色無晶形固体 NMR スペクトル $\delta$ (CDCl <sub>3</sub> )ppm:0.85(3H,t,J=7.5Hz),1.00-1.70(20H,m),1.04(3H,d,J=7.5Hz),1.06(3H,t,J=6Hz),1.10(3H,d,J=7.5Hz),1.90-2.00(3H,m),2.05-2.13(1H,m),2.19(3H,s),2.22-2.45(1H,m),2.35(1H,s),2.50-2.80(6H,m),3.17(1H,s),3.25(1H,dd,J=10,5,7.5Hz),3.42-4.15(5H,m),3.51(1H,d,J=2Hz),3.61(1H,s),3.69(1H,s),3.93(1H,brs),4.36-4.44(2H,m),5.23(1H,dd,J=11.5,2Hz),7.10-7.32(5H,m)
55		淡褐色無晶形固体 NMR スペクトル $\delta$ (CDCl <sub>3</sub> )ppm:0.85(3H,t,J=7.5Hz),0.95-1.83(33H,m),1.88-2.00(1H,m),2.05-2.13(1H,m),2.20(3H,s),2.28(1H,s),2.30-2.41(1H,m),2.49-2.72(6H,m),3.17(1H,s),3.25(1H,dd,J=10,7.5Hz),3.42-3.76(3H,m),3.50(1H,d,J=2Hz),3.58(1H,s),3.68(1H,s),3.82(1H,brs),3.98-4.10(2H,m),4.32-4.41(1H,m),4.38(1H,s),5.23(1H,dd,J=11.2,5Hz),7.10-7.35(5H,m)




【0098】

【表42】

参考例	R <sup>3</sup>	性状及び物性
56		無色無晶形固体 NMR スペクトル $\delta$ (CDCl <sub>3</sub> )ppm:0.85(3H,t,J=7.5Hz),0.95-1.82(35H,m),1.88-2.00(1H,m),2.05-2.13(1H,m),2.20(3H,s),2.27(1H,s),2.30-2.41(1H,m),2.49-2.72(6H,m),3.17(1H,s),3.25(1H,dd,J=10.5,7.5Hz),3.47-3.73(3H,m),3.50(1H,d,J=2Hz),3.60(1H,s),3.67(1H,s),3.85-4.08(2H,m),3.93(1H,brs),4.39(1H,d,J=8Hz),4.40(1H,s),5.23(1H,dd,J=11.2,5Hz),7.10-7.35(5H,m)
57		淡褐色無晶形固体 NMR スペクトル $\delta$ (CDCl <sub>3</sub> )ppm:0.85(3H,t,J=7.5Hz),0.95-1.70(29H,m),1.88-1.99(1H,m),2.06-2.15(1H,m),2.19(3H,s),2.29-2.38(1H,m),2.34(1H,s),2.47-2.73(4H,m),3.16(1H,s),3.23(1H,dd,J=10.5,7.5Hz),3.43(1H,d,J=2Hz),3.46-3.55(2H,m),3.53(1H,s),3.70-3.78(1H,m),3.77(1H,s),3.90(1H,brs),4.10-4.20(2H,m),4.32(1H,s),4.34(1H,d,J=7.5Hz),4.35-4.41(2H,m),5.24(1H,dd,J=11.2,5Hz),6.93(2H,d,J=8Hz),6.97(1H,t,J=7.5Hz),7.23-7.34(2H,m)
58		無色無晶形固体 NMR スペクトル $\delta$ (CDCl <sub>3</sub> )ppm:0.85(3H,t,J=7.5Hz),0.95-1.73(29H,m),1.87-2.00(1H,m),2.03-2.23(3H,m),2.20(3H,s),2.27(1H,s),2.30-2.40(1H,m),2.48-2.73(4H,m),3.16(1H,s),3.25(1H,dd,J=10.5,7.5Hz),3.43-3.77(4H,m),3.48(1H,d,J=2Hz),3.69(1H,s),3.92(1H,brs),4.05(2H,t,J=6Hz),4.17-4.30(2H,m),4.33(1H,s),4.37(1H,d,J=7.5Hz),5.23(1H,dd,J=11.2,5Hz),6.86-6.98(3H,m),7.23-7.32(2H,m)
59		淡褐色無晶形固体 NMR スペクトル $\delta$ (CDCl <sub>3</sub> )ppm:0.85(3H,t,J=7.5Hz),0.98-2.00(34H,m),2.05-2.13(1H,m),2.19(3H,s),2.29-2.40(1H,m),2.32(1H,s),2.49-2.71(4H,m),3.17(1H,s),3.25(1H,dd,J=10.5,7.5Hz),3.48-3.57(1H,m),3.49(1H,d,J=2Hz),3.58(1H,s),3.59(1H,d,J=6.5Hz),3.68-3.76(1H,m),3.70(1H,s),3.92(1H,brs),3.95-4.02(2H,m),4.11(2H,t,J=6Hz),4.37(1H,d,J=7.5Hz),4.38(1H,s),5.23(1H,dd,J=11.2,5Hz),6.80-6.95(3H,m),7.20-7.30(2H,m)

【0099】

【表43】

参考例	R <sup>3</sup>	性状及び物性
60		無色無晶形固体 NMR スペクトル $\delta$ (CDCl <sub>3</sub> )ppm:0.85(3H,t,J=7.5Hz),1.00-1.11(6H,m),1.10(3H,d,J=7.5Hz),1.15-1.70(20H,m),1.88-1.98(1H,m),2.06-2.13(1H,m),2.20(3H,s),2.30-2.38(1H,m),2.47(1H,s),2.49-2.72(4H,m),3.07-3.19(2H,m),3.15(1H,s),3.25(1H,dd,J=10.7.5Hz),3.48-3.62(3H,m),3.50(1H,d,J=2Hz),3.69-3.76(1H,m),3.74(1H,s),3.91(1H,brs),4.09-4.25(2H,m),4.21(1H,s),4.38(1H,d,J=7.5Hz),5.23(1H,dd,J=11.2.5Hz),7.20-7.40(5H,m)
61		褐色無晶形固体 NMR スペクトル $\delta$ (CDCl <sub>3</sub> )ppm:0.85(3H,t,J=7.5Hz),0.97-1.70(26H,m),1.09(3H,d,J=7.5Hz),1.88-1.98(1H,m),2.02-2.12(1H,m),2.11(1H,s),2.20(3H,s),2.30-2.40(1H,m),2.49-2.72(4H,m),3.10-3.28(3H,m),3.25(1H,dd,J=10.5.7.5Hz),3.48(1H,d,J=2Hz),3.50-3.65(2H,m),3.60(1H,s),3.65-3.76(1H,m),3.69(1H,s),3.93(1H,brs),4.21-4.33(2H,m),4.32(1H,s),4.37(1H,d,J=7.5Hz),5.23(1H,dd,J=11.2.5Hz),6.83(1H,d,J=3.5Hz),6.93(1H,dd,J=5.5.3.5Hz),7.15(1H,d,J=5.5Hz)
62		淡褐色無晶形固体 NMR スペクトル $\delta$ (CDCl <sub>3</sub> )ppm:0.85(3H,t,J=7.5Hz),0.99(3H,d,J=6.5Hz),1.05(3H,t,J=7.5Hz),1.08(3H,d,J=7.5Hz),1.15-1.80(21H,m),1.88-2.00(1H,m),2.02-2.10(1H,m),2.20(3H,s),2.30-2.41(1H,m),2.40(1H,s),2.50-2.72(4H,m),2.94(3H,s),3.16(1H,s),3.25(1H,dd,J=10.5.7.5Hz),3.46(1H,d,J=1Hz),3.48-3.60(4H,m),3.61-3.72(1H,m),3.71(1H,s),3.93(1H,brs),4.22(2H,t,J=5.5Hz),4.29(1H,s),4.37(1H,d,J=7.5Hz),5.23(1H,dd,J=11.2Hz),6.67-6.75(3H,m),7.20-7.30(2H,m)

## 【0100】参考例63

2'-O-アセチル-3'-N-デメチル-5-O-デサミニル-3'-N-エチルエリスロノライドA 9-[O-[3-(4-ピリジル)プロピル]オキシム]

3'-N-デメチル-5-O-デサミニル-3'-N-エチルエリスロノライドA 9-[O-[3-(4-ピリジル)プロピル]オキシム] 3.00gのアセトン30ml溶液に室温攪拌下、無水酢酸0.47mlを加え、室温で5時間攪拌した。反応液を減圧濃縮し、残渣に炭酸水素ナトリウム水溶液を加えアルカリ性とし、酢酸エチルで抽出した。抽出液を水、飽和食塩水で順次洗浄、硫酸ナトリウムで乾燥後、溶媒を減圧留去し、淡黄色無晶形固体2.80gを得た。

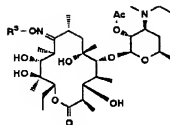
NMR スペクトル  $\delta$  (CDCl<sub>3</sub>)ppm:0.85(3H,t,J=7.5Hz),0.94(3H,d,J=7.5Hz),0.98(3H,t,J=7Hz),1.04(3H,d,J=6.5Hz),1.12-1.80(22H,m),1.88-2.17(4H,m),2.04(3H,s),2.21(3H,s),2.31-2.42(1H,m),2.48-2.58(1H,m),2.63-2.80(5H,m),3.12(1H,s),3.40-3.58(1H,m),3.50(1H,d,J=10.5Hz),3.55(1H,d,J=3.5Hz),3.59-3.72(1H,m),3.69(1H,s),4.01-4.12(2H,m),4.38(1H,s),4.58(1H,d,J=7.5Hz),4.76(1H,dd,J=10.7.5Hz),5.23(1H,dd,J=11.2.5Hz),7.12(2H,d,J=5.5Hz),8.50(2H,d,J=5.5Hz)

【0101】参考例63と同様にして、参考例64へ参考例93の化合物を得た。

【0102】

【表44】





参考例	R <sup>3</sup>	性状及び物性
64	Me	無色無晶形固体 NMRスペクトル δ (CDCl <sub>3</sub> )ppm:0.84(3H,t,J=7.5Hz),0.93(3H,d,J=7.5Hz),0.98(3H,t,J=7Hz),1.03(3H,d,J=6.5Hz),1.10-1.80(21H,m),1.90-2.00(1H,m),1.94(1H,s),2.04(3H,s),2.08-2.17(1H,m),2.21(3H,s),2.31-2.40(1H,m),2.48-2.58(1H,m),2.61-2.69(2H,m),2.70-2.77(1H,m),3.15(1H,s),3.42-3.57(2H,m),3.55(1H,d,J=3Hz),3.58-3.70(1H,m),3.68(1H,s),3.83(3H,s),4.45(1H,s),4.57(1H,d,J=7.5Hz),4.75(1H,dd,J=10.5,7.5Hz),5.24(1H,dd,J=11.5,2Hz)
65	Et	無色無晶形固体 NMRスペクトル δ (CDCl <sub>3</sub> )ppm:0.84(3H,t,J=7.5Hz),0.93(3H,d,J=7.5Hz),0.98(3H,t,J=7Hz),1.03(3H,d,J=7.5Hz),1.08-2.00(25H,m),1.85(1H,brs),2.04(3H,s),2.07-2.17(1H,m),2.21(3H,s),2.3-2.41(1H,m),2.49-2.58(1H,m),2.60-2.80(3H,m),3.15(1H,s),3.40-3.71(2H,m),3.51(1H,d,J=10Hz),3.55(1H,d,J=3.5Hz),3.67(1H,s),4.08(2H,q,J=7Hz),4.51(1H,s),4.57(1H,d,J=8Hz),4.76(1H,d,J=10.5,7.5Hz),5.23(1H,dd,J=11.5,2Hz)
66	n-Pr	無色無晶形固体 NMRスペクトル δ (CDCl <sub>3</sub> )ppm:0.84(3H,t,J=7.5Hz),0.88-1.85(30H,m),0.98(3H,t,J=7Hz),1.03(3H,d,J=6.5Hz),1.90-2.01(1H,m),2.04(3H,s),2.08-2.17(1H,m),2.21(3H,s),2.30-2.41(1H,m),2.48-2.58(1H,m),2.61-2.79(3H,m),3.16(1H,s),3.40-3.57(2H,m),3.55(1H,d,J=3Hz),3.60-3.70(1H,m),3.67(1H,s),3.92-4.05(2H,m),4.51(1H,s),4.57(1H,d,J=8Hz),4.76(1H,dd,J=10.5,8Hz),5.23(1H,dd,J=11.2Hz)



【0103】

【表45】

参考例	R <sup>3</sup>	性状及び物性
67	i-Pr	無色無晶形固体 NMRスペクトル $\delta$ (CDCl <sub>3</sub> )ppm:0.84(3H,t,J=7.5Hz),0.93(3H,d,J=7.5Hz),0.98(3H,t,J=7Hz),1.03(3H,d,J=7.5Hz),1.10-1.70(2 6H,m),1.76(1H,d,J=6.5Hz),1.89-2.00(1H,m),2.04(3H,s),2.09-2.16(1H,m),2.13(1H,s),2.21(3H,s),2.30-2.40(1H,m),2.50-2.57(1 H,m),2.60-2.77(3H,m),3.15(1H,s),3.40-3.68(3H,m),3.56(1H,d,J =3.5Hz),3.67(1H,s),4.22-4.32(1H,m),4.55(1H,s),4.57(1H,d,J=7. 5Hz),4.76(1H,dd,J=10.5,8Hz),5.23(1H,dd,J=11,2Hz)
68	n-Bu	淡黄色無晶形固体 NMR スペクトル $\delta$ (CDCl <sub>3</sub> )ppm:0.84(3H,t,J=7.5Hz),0.93(3H,d,J=7.5Hz),0.93(3H,t,J=7.5Hz),0.98(3H,t,J=7Hz),1.03(3H,d,J=7.5Hz),1.10-1.80(23H,m),1.90-2.00(1H,m),2.03(1H,s),2.04(3H,s),2.07-2.25(1H,m),2.21(3H,s),2.30-2.40(1H,m),2.48-2.58(1H,m),2.60-2.80(3H,m),3.15(1H,s),3.40-3.56(4H,m),3.55(1H,d,J=3Hz),3.60-3.70(1H,m),3.67(1H,s),3.92-4.10(2H,m),4.50(1H,s),4.57(1H,d,J=7.5Hz),4.76(1H,dd,J=10.5,8Hz),5.23(1H,dd,J=11,2.5Hz)
69	i-Bu	無色無晶形固体 NMRスペクトル $\delta$ (CDCl <sub>3</sub> )ppm:0.84(3H,t,J=7.5Hz),0.82(3H,d,J=6.5Hz),0.93(3H,d,J=6.5Hz),0.99(3H,t,J=7Hz),1.03(3H,d,J=7.5Hz),1.10-1.75(24H,m),1.88-2.00(2H,m),2.03(1H,s),2.05(3H,s),2.08-2.45(2H,m),2.22(3H,s),2.50-2.60(1H,m),2.61-2.70(2H,m),2.72-2.83(1H,m),3.16(1H,s),3.40-3.57(1H,m),3.51(1H,d,J=10.5Hz),3.55(1H,d,J=3.5Hz),3.60-3.70(1H,m),3.67(1H,s),3.73-3.88(2H,m),4.50(1H,s),4.58(1H,d,J=7.5Hz),4.77(1H,dd,J=10.5,8Hz),5.23(1H,dd,J=11.5,2Hz)
70	sec-Bu	無色無晶形固体 NMRスペクトル $\delta$ (CDCl <sub>3</sub> )ppm:0.84(3H,t,J=7.5Hz),0.86-0.95 (6H,m),0.98(3H,t,J=7Hz),1.02(3H,d,J=6.5Hz),1.10-2.00(25H,m),2.04(3H,s),2.08,2.13(total 1H,each s),2.10-2.15(1H,m),2.21(3H,s),2.30-2.40(1H,m),2.49-2.57(1H,m),2.60-2.76(3H,m),3.16,3.16(total 1H,each s),3.40-3.58(2H,m),3.56(1H,d,J=3H z),3.60-3.70(1H,m),3.67(1H,s),4.03-4.15(1H,m),4.54,4.55(tota l 1H,each s),4.58(1H,d,J=7.5Hz),4.76(1H,dd,J=10.5,7.5Hz),5.23(1H,dd,J=11.2,5Hz)



【0104】

【表46】

参考例	R <sup>2</sup>	性状及び物性
71	i-Pent	無色無晶形固体 NMRスペクトル $\delta$ (CDCl <sub>3</sub> )ppm:0.84(3H,t,J=7.5Hz),0.88-2.00(34H,m),0.99(3H,t,J=7Hz),1.02(3H,d,J=6.5Hz),2.03(1H,s),2.04(3H,s),2.07-2.15(1H,m),2.21(3H,s),2.30-2.40(1H,m),2.48-2.57(1H,m),2.60-2.79(3H,m),3.15(1H,s),3.42-3.58(2H,m),3.55(1H,d,J=3Hz),3.60-3.70(1H,m),3.67(1H,s),4.05(2H,t,J=7Hz),4.50(1H,s),4.57(1H,d,J=8Hz),4.76(1H,dd,J=10.5,7.5Hz),5.23(1H,dd,J=11.2Hz)
72		淡黄色無晶形固体 NMRスペクトル $\delta$ (CDCl <sub>3</sub> )ppm:0.80-1.82(37H,m),0.98(3H,t,J=7Hz),1.02(3H,d,J=6.5Hz),1.89-1.99(1H,m),2.04(3H,s),2.08(1H,s),2.10-2.17(1H,m),2.21(3H,s),2.31-2.40(1H,m),2.49-2.58(1H,m),2.61-2.78(3H,m),3.16(1H,s),3.40-3.50(1H,m),3.52(1H,d,J=10Hz),3.56(1H,d,J=3Hz),3.62-3.71(1H,m),3.67(1H,s),3.88-3.96(1H,m),4.55(1H,s),4.58(1H,d,J=8Hz),4.76(1H,dd,J=10.5,8Hz),5.23(1H,dd,J=11.25Hz)
73	n-Hex	淡褐色無晶形固体 NMRスペクトル $\delta$ (CDCl <sub>3</sub> )ppm:0.84(3H,t,J=7.5Hz),0.89(3H,t,J=6.5Hz),0.93(3H,d,J=7.5Hz),0.98(3H,t,J=7Hz),1.03(3H,d,J=7.5Hz),1.10-1.71(28H,m),1.74(1H,d,J=6.5Hz),1.89-2.00(1H,m),2.04(3H,s),2.04(1H,s),2.08-2.15(1H,m),2.21(3H,s),2.30-2.40(1H,m),2.49-2.57(1H,m),2.61-2.77(3H,m),3.15(1H,s),3.41-3.56(2H,m),3.55(1H,d,J=3Hz),3.60-3.68(1H,m),3.67(1H,s),3.95-4.05(2H,m),4.51(1H,s),4.57(1H,d,J=7.5Hz),4.75(1H,dd,J=10.5,7.5Hz),5.23(1H,dd,J=11.5,2Hz)
74		無色無晶形固体 NMRスペクトル $\delta$ (CDCl <sub>3</sub> )ppm:0.84(3H,t,J=7.5Hz),0.89(3H,t,J=7.5Hz),0.90(3H,t,J=7.5Hz),0.93(3H,d,J=8Hz),0.98(3H,t,J=7Hz),1.03(3H,d,J=7.5Hz),1.10-2.00(27H,m),1.99(1H,s),2.04(3H,s),2.10-2.16(1H,m),2.21(3H,s),2.31-2.40(1H,m),2.50-2.58(1H,m),2.60-2.78(3H,m),3.16(1H,s),3.40-3.50(1H,m),3.51(1H,d,J=11.5Hz),3.55(1H,d,J=3.5Hz),3.60-3.70(1H,m),3.67(1H,s),3.90-4.00(1H,m),4.51(1H,s),4.57(1H,d,J=7.5Hz),4.76(1H,dd,J=10.5,8Hz),5.23(1H,dd,J=11.25Hz)

【0105】

【表47】

参考例	R <sup>2</sup>	性状及び物性
75	n-Oct	<p>無色無晶形固体</p> <p>NMRスペクトル <math>\delta</math> (CDCl<sub>3</sub>)ppm:0.84(3H,t,J=7.5Hz),0.89(3H,t,J=6.5Hz),0.93(3H,d,J=8Hz),0.98(3H,t,J=7Hz),1.03(3H,d,J=7.5Hz),1.06-1.75(33H,m),1.89-2.00(1H,m),2.04(1H,s),2.05(3H,s),2.08-2.16(1H,m),2.21(3H,s),2.31-2.40(1H,m),2.49-2.57(1H,m),2.60-2.70(2H,m),2.70-2.77(1H,m),3.15(1H,s),3.42-3.58(2H,m),3.55(1H,d,J=3Hz),3.60-3.70(1H,m),3.67(1H,s),3.96-4.05(2H,m),4.50(1H,s),4.57(1H,d,J=7.5Hz),4.76(1H,dd,J=10.7,7.5Hz),5.23(1H,dd,J=11.2Hz)</p>
76	n-Dodec	<p>淡褐色無晶形固体</p> <p>NMRスペクトル <math>\delta</math> (CDCl<sub>3</sub>)ppm:0.84(3H,t,J=7.5Hz),0.88(3H,t,J=7Hz),0.93(3H,d,J=7.5Hz),0.98(3H,t,J=7Hz),1.03(3H,d,J=7.5Hz),1.10-1.75(41H,m),1.90-1.99(1H,m),2.03(1H,s),2.04(3H,s),2.09-2.16(1H,m),2.21(3H,s),2.30-2.40(1H,m),2.48-2.57(1H,m),2.60-2.70(2H,m),2.70-2.76(1H,m),3.15(1H,s),3.40-3.56(2H,m),3.55(1H,d,J=3Hz),3.60-3.68(1H,m),3.67(1H,s),3.95-4.05(2H,m),4.48(1H,s),4.57(1H,d,J=8Hz),4.75(1H,dd,J=10.5,7.5Hz),5.23(1H,dd,J=11.2,5Hz)</p>
77		<p>淡黄色無晶形固体</p> <p>NMR スペクトル <math>\delta</math> (CDCl<sub>3</sub>)ppm:0.84(3H,t,J=7.5Hz),0.93(3H,d,J=7.5Hz),0.98(3H,t,J=7Hz),1.03(3H,d,J=6.5Hz),1.10-2.00(27H,m),1.46(9H,s),2.04(3H,s),2.07-2.15(1H,m),2.21(3H,s),2.30-2.40(1H,m),2.48-2.58(1H,m),2.60-2.78(3H,m),3.08-3.25(2H,m),3.11(1H,s),3.40-3.57(2H,m),3.55(1H,d,J=3Hz),3.60-3.80(3H,m),3.68(1H,s),4.13-4.26(1H,m),4.39(1H,s),4.57(1H,d,J=7.5Hz),4.76(1H,dd,J=10.5,7.5Hz),5.22(1H,dd,J=11.5,2Hz)</p>
78		<p>無色無晶形固体</p> <p>NMR スペクトル <math>\delta</math> (CDCl<sub>3</sub>)ppm:0.84(3H,t,J=7.5Hz),0.93(3H,d,J=7.5Hz),0.98(3H,t,J=7Hz),1.02(3H,d,J=6.5Hz),1.08-2.18(30H,m),2.04(3H,s),2.21(3H,s),2.31-2.42(1H,m),2.49-2.69(4H,m),2.70-2.80(1H,m),3.15(1H,s),3.40-3.58(1H,m),3.51(1H,d,J=11Hz),3.55(1H,d,J=3Hz),3.60-3.70(1H,m),3.67(1H,s),3.94-4.05(2H,m),4.48(1H,s),4.57(1H,d,J=8Hz),4.76(1H,dd,J=10.5,7.5Hz),5.23(1H,dd,J=11.5,2Hz)</p>





【0106】

【表48】

参考例	R <sup>2</sup>	性状及び物性
79		無色無晶形固体 NMR スペクトル $\delta$ (CDCl <sub>3</sub> )ppm:0.84(3H,t,J=7.5Hz),0.90-2.00(31H,m),0.93(3H,d,J=7.5Hz),0.98(3H,t,J=7Hz),1.03(3H,d,J=6.5Hz),2.04(3H,s),2.10-2.26(2H,m),2.21(3H,s),2.30-2.40(1H,m),2.48-2.58(1H,m),2.60-2.80(3H,m),3.15(1H,s),3.40-3.58(1H,m),3.51(1H,d,J=11Hz),3.55(1H,d,J=3Hz),3.60-3.72(1H,m),3.67(1H,s),3.70-3.98(2H,m),4.51(1H,s),4.57(1H,d,J=8Hz),4.76(1H,d,J=10.5,8Hz),5.23(1H,dd,J=11.2Hz)
80		無色無晶形固体 NMR スペクトル $\delta$ (CDCl <sub>3</sub> )ppm:0.84(3H,t,J=7.5Hz),0.90-1.85(32H,m),0.93(3H,d,J=8Hz),0.98(3H,t,J=7Hz),1.03(3H,d,J=7.5Hz),1.89-1.99(1H,m),2.04(1H,s),2.04(3H,s),2.07-2.15(1H,m),2.21(3H,s),2.30-2.40(1H,m),2.48-2.57(1H,m),2.80-2.77(3H,m),3.15(1H,s),3.42-3.68(1H,m),3.51(1H,d,J=10.5Hz),3.56(1H,d,J=3.5Hz),3.60-3.68(1H,m),3.66(1H,s),3.79-3.88(2H,m),4.51(1H,s),4.57(1H,d,J=8Hz),4.76(1H,dd,J=10.5,7.5Hz),5.23(1H,dd,J=11.5,2Hz)
81		無色無晶形固体 NMR スペクトル $\delta$ (CDCl <sub>3</sub> )ppm:0.80-2.25(36H,m),0.84(3H,t,J=7.5Hz),0.93(3H,d,J=7.5Hz),0.98(3H,t,J=7Hz),1.03(3H,d,J=7.5Hz),2.02(1H,s),2.04(3H,s),2.21(3H,s),2.30-2.40(1H,m),2.48-2.58(1H,m),2.60-2.80(3H,m),3.15(1H,s),3.40-3.70(3H,m),3.55(1H,d,J=3Hz),3.67(1H,s),4.05(2H,t,J=7Hz),4.50(1H,s),4.57(1H,d,J=8Hz),4.76(1H,dd,J=10.5,8Hz),5.23(1H,dd,J=11.2Hz)
82		無色無晶形固体 NMR スペクトル $\delta$ (CDCl <sub>3</sub> )ppm:0.80-1.80(37H,m),0.84(3H,t,J=7.5Hz),0.93(3H,d,J=7.5Hz),0.98(3H,t,J=7Hz),1.03(3H,d,J=7.5Hz),1.89-2.00(1H,m),2.03(3H,s),2.08-2.17(1H,m),2.21(3H,s),2.30-2.40(1H,m),2.48-2.58(1H,m),2.60-2.74(3H,m),3.15(1H,s),3.41-3.60(2H,m),3.55(1H,d,J=3Hz),3.60-3.70(1H,m),3.67(1H,s),3.90-4.06(2H,m),4.50(1H,s),4.57(1H,d,J=7.5Hz),4.76(1H,dd,J=10.5,7.5Hz),5.23(1H,dd,J=11.5,2Hz)





[0107]

【表49】

参考例	R <sup>3</sup>	性状及び物性
83		無色無晶形固体 NMR スペクトル $\delta$ (CDCl <sub>3</sub> )ppm:0.84(3H,t,J=7.5Hz),0.91(3H,d,J=7.5Hz),0.97(3H,t,J=7.5Hz),0.99(3H,d,J=7.5Hz),1.09-1.75(21H,m),1.78(1H,s),1.89-2.00(1H,m),2.04(3H,s),2.07-2.16(1H,m),2.20(3H,s),2.30-2.40(1H,m),2.48-2.57(1H,m),2.60-2.78(3H,m),3.15(1H,s),3.40-3.56(2H,m),3.52(1H,d,J=3.5Hz),3.62-3.72(1H,m),3.69(1H,s),4.41(1H,s),4.55(1H,d,J=8Hz),4.74(1H,dd,J=10.5,7.5Hz),5.04(1H,d,J=12Hz),5.07(1H,d,J=12Hz),5.24(1H,d,J=11.2,5Hz),7.20-7.40(5H,m)
84		無色無晶形固体 NMR スペクトル $\delta$ (CDCl <sub>3</sub> )ppm:0.84(3H,t,J=7.5Hz),0.92(3H,d,J=8Hz),0.94-1.80(27H,m),1.75(1H,s),1.88-2.00(1H,m),2.04(3H,s),2.06-2.15(1H,m),2.21(3H,s),2.30-2.40(1H,m),2.48-2.58(1H,m),2.60-2.78(3H,m),2.94(2H,t,J=7.5Hz),3.15(1H,s),3.40-3.60(3H,m),3.49(1H,d,J=3Hz),3.68(1H,s),4.20-4.32(2H,m),4.47(1H,s),4.55(1H,d,J=7.5Hz),4.74(1H,dd,J=10.5,7.5Hz),5.24(1H,dd,J=11.5,2Hz),7.15-7.35(5H,m)
85		淡褐色無晶形固体 NMR スペクトル $\delta$ (CDCl <sub>3</sub> )ppm:0.84(3H,t,J=7.5Hz),0.93(3H,d,J=8Hz),0.98(3H,t,J=7Hz),1.04(3H,d,J=6.5Hz),1.15-1.57(18H,m),1.65-2.00(4H,m),2.03(1H,s),2.05(3H,s),2.08-2.17(1H,m),2.21(3H,s),2.30-2.40(1H,m),2.48-2.60(1H,m),2.62-2.90(5H,m),3.15(1H,s),3.40-3.58(1H,m),3.51(1H,d,J=11Hz),3.55(1H,d,J=3.5Hz),3.60-3.70(1H,m),3.68(1H,s),4.00-4.15(2H,m),4.46(1H,s),4.57(1H,d,J=7.5Hz),4.76(1H,dd,J=10.5,7.5Hz),5.24(1H,dd,J=11.2,5Hz),7.10-7.28(5H,m)
86		無色無晶形固体 NMR スペクトル $\delta$ (CDCl <sub>3</sub> )ppm:0.84(3H,t,J=7.5Hz),0.93(3H,d,J=8Hz),0.98(3H,t,J=7Hz),1.02(3H,d,J=6.5Hz),1.06-1.85(25H,m),1.90-2.00(1H,m),1.98(1H,s),2.04(3H,s),2.08-2.17(1H,m),2.21(3H,s),2.31-2.41(1H,m),2.48-2.79(6H,m),3.14(1H,s),3.40-3.56(2H,m),3.54(1H,d,J=3.5Hz),3.58-3.70(1H,m),3.67(1H,s),3.95-4.10(2H,m),4.47(1H,s),4.57(1H,d,J=8Hz),4.76(1H,dd,J=10.5,7.5Hz),5.23(1H,dd,J=11.5,2Hz),7.10-7.35(5H,m)

【0108】

【表50】

参考例	R <sup>3</sup>	性状及び物性
87		無色無晶形固体 NMR スペクトル $\delta$ (CDCl <sub>3</sub> )ppm:0.84(3H,t,J=7.5Hz),0.93(3H,d,J=8Hz),0.98(3H,t,J=7Hz),1.01(3H,d,J=7.5Hz),1.07-1.83(27H,m),1.90-2.00(1H,m),2.00(1H,s),2.04(3H,s),2.08-2.17(1H,m),2.13(3H,s),2.30-2.40(1H,m),2.48-2.79(6H,m),3.14(1H,s),3.40-3.70(3H,m),3.54(1H,d,J=3Hz),3.66(1H,s),3.97-4.08(2H,m),4.48(1H,s),4.57(1H,d,J=7.5Hz),4.76(1H,dd,J=10.5,8Hz),5.23(1H,d,J=11.5,2Hz),7.10-7.35(5H,m)
88		淡褐色無晶形固体 NMR スペクトル $\delta$ (CDCl <sub>3</sub> )ppm:0.85(3H,t,J=7.5Hz),0.91(3H,d,J=7.5Hz),0.97(3H,t,J=7Hz),1.00(3H,d,J=7.5Hz),1.10-1.71(21H,m),1.89-2.00(1H,m),2.03(3H,s),2.08(1H,s),2.09-2.18(1H,m),2.20(3H,s),2.30-2.39(1H,m),2.46-2.56(1H,m),2.60-2.75(3H,m),3.14(1H,s),3.40-3.50(2H,m),3.45(1H,d,J=3.5Hz),3.61-3.72(1H,m),3.77(1H,s),4.09-4.19(2H,m),4.36-4.41(2H,m),4.40(1H,s),4.52(1H,d,J=8Hz),4.74(1H,dd,J=10.5,7.5Hz),5.25(1H,dd,J=11.2,5Hz),6.93(2H,d,J=8.5Hz),6.97(1H,t,J=7Hz),7.26-7.33(2H,m)
89		無色無晶形固体 NMR スペクトル $\delta$ (CDCl <sub>3</sub> )ppm:0.84(3H,t,J=7.5Hz),0.93(3H,d,J=7.5Hz),0.98(3H,t,J=7Hz),1.02(3H,d,J=6.5Hz),1.07-1.77(21H,m),1.88-2.00(1H,m),1.91(1H,s),2.04(3H,s),2.06-2.18(3H,m),2.21(3H,s),2.30-2.40(1H,m),2.47-2.58(1H,m),2.60-2.79(3H,m),3.14(1H,s),3.40-3.55(2H,m),3.52(1H,d,J=3Hz),3.58-3.70(1H,m),3.69(1H,s),4.05(2H,t,J=6Hz),4.16-4.28(2H,m),4.44(1H,s),4.56(1H,d,J=7.5Hz),4.75(1H,dd,J=10.5,7.5Hz),5.23(1H,dd,J=11.5,2Hz),6.87-6.97(3H,m),7.23-7.32(2H,m)
90		淡黄色無晶形固体 NMR スペクトル $\delta$ (CDCl <sub>3</sub> )ppm:0.84(3H,t,J=7.5Hz),0.93(3H,d,J=7.5Hz),0.98(3H,t,J=7Hz),1.02(3H,d,J=7.5Hz),1.10-1.90(25H,m),1.90-2.00(1H,m),2.01(1H,s),2.04(3H,s),2.07-2.16(1H,m),2.21(3H,s),2.30-2.40(1H,m),2.48-2.57(1H,m),2.60-2.77(3H,m),3.15(1H,s),3.40-3.51(2H,m),3.53(1H,d,J=3.5Hz),3.60-3.70(1H,m),3.69(1H,s),3.94-4.02(2H,m),4.10(2H,t,J=6Hz),4.47(1H,s),4.56(1H,d,J=8Hz),4.75(1H,dd,J=10.5,8Hz),5.23(1H,dd,J=11.2,5Hz),6.80-6.95(3H,m),7.20-7.30(2H,m)

【0109】

【表51】

参考例	R <sup>3</sup>	性状及び物性
91		淡黄色無晶形固体 NMR スペクトル $\delta$ (CDCl <sub>3</sub> )ppm:0.85(3H,t,J=7.5Hz),0.93(3H,d,J=7.5Hz),0.98(3H,t,J=7Hz),1.02(3H,d,J=6.5Hz),1.10-1.72(2 1H,m),1.90-2.00(1H,m),2.04(3H,s),2.10-2.22(1H,m),2.18(1H,s),2.21(3H,s),2.31-2.39(1H,m),2.49-2.56(1H,m),2.61-2.77(3H,m),3.06-3.20(2H,m),3.14(1H,s),3.40-3.58(2H,m),3.53(1H,d,J=3Hz),3.60-3.70(1H,m),3.74(1H,s),4.10-4.22(2H,m),4.31(1H,s),4.56(1H,d,J=8Hz),4.76(1H,dd,J=10.5,8Hz),5.24(1H,dd,J=11.2 Hz),7.19-7.41(5H,m)
92		褐色無晶形固体 NMR スペクトル $\delta$ (CDCl <sub>3</sub> )ppm:0.84(3H,t,J=7.5Hz),0.92(3H,d,J=7.5Hz),0.98(3H,t,J=7Hz),1.01(3H,d,J=6.5Hz),1.10-1.76(2 2H,m),1.90-2.00(1H,m),2.04(3H,s),2.07-2.15(1H,m),2.21(3H,s),2.30-2.40(1H,m),2.48-2.57(1H,m),2.60-2.77(3H,m),3.10-3.20(2H,m),3.14(1H,s),3.41-3.52(2H,m),3.51(1H,d,J=3.5Hz),3.59-3.68(1H,m),3.69(1H,s),4.20-4.30(2H,m),4.40(1H,s),4.55(1H,d,J=7.5Hz),4.75(1H,dd,J=10.5,8Hz),5.23(1H,dd,J=11.2,5Hz),6.8 3(1H,d,J=3.5Hz),6.93(1H,dd,J=5.5,3.5Hz),7.15(1H,dd,J=5.5,1H z)
93		無色無晶形固体 NMR スペクトル $\delta$ (CDCl <sub>3</sub> )ppm:0.84(3H,t,J=7.5Hz),0.90-1.72 (27H,m),0.92(3H,d,J=7.5Hz),1.91-2.00(1H,m),2.03(1H,s),2.04 (3H,s),2.07-2.15(1H,m),2.20(3H,s),2.30-2.40(1H,m),2.47-2.57 (1H,m),2.60-2.78(3H,m),2.93(3H,s),3.13(1H,s),3.40-3.62(6H, m),3.71(1H,s),4.21(2H,t,J=6Hz),4.39(1H,s),4.55(1H,d,J=8Hz), 4.74(1H,dd,J=10.5,8Hz),5.24(1H,dd,J=11.2,5Hz),6.68-6.77(3 H,m),7.20-7.30(2H,m)

## 【0110】参考例94

3-O-(4-クロロフェニル)アセチル-3'-N-  
デメチル-5-O-デソサニルエリスロノライドA  
9-(O-シクロヘキシルオキシム)3-O-(4-  
クロロフェニル)アセチル-5-O-デソサニルエリス  
ロノライドA 9-(O-シクロヘキシルオキシム)

1.60gのメタノール30ml溶液に水3ml, 酢酸ナトリウム三水合物1.32g, ヨウ素0.52gを順次加え、レフランプを照射しながら外温50℃にて2時間攪拌した。反応液を減圧濃縮し、残渣に酢酸エチルを加え、水酸化ナトリウム水溶液、炭酸水素ナトリウム水溶液、水、チオ硫酸ナトリウム水溶液、水、飽和食塩水で順次洗浄、硫酸ナトリウムで乾燥後、溶媒を減圧留去した。得られた残渣をジソプロピルエーテルとn-ヘプタンの混合溶媒にて洗浄し無色固体1.07gを得た。  
NMRスペクトル  $\delta$  (CDCl<sub>3</sub>)ppm:0.81(3H,t,J=7.5Hz),0.89(3H,d,J=6.5Hz),0.95-2.00(33H,m),1.02(3H,d,J=7.5Hz),2.04(1H,s),2.22-2.42(2H,m),2.42(3H,s),2.60-2.67(1H,m),2.72-2.81(1H,m),3.02-3.20(1H,m),3.09(1H,d,J=9.5,7.5Hz),3.15(1H,brs),3.46(1H,d,J=3.5Hz),3.59-3.72(1H,m),3.63(1H,d,J=14.5Hz),3.67(1H,d,J=14.5Hz),3.69(1H,s),3.91(1H,d,J=7.5Hz),3.95-4.03(1H,m),4.55(1H,s),5.15(1H,d,J=11Hz),5.21(1H,dd,J=11.2Hz),

7.20-7.35(4H,m)

## 【0111】実施例1

3-O-(4-クロロフェニル)アセチル-3'-N-  
デメチル-5-O-デソサニルエリスロノライドA 9-[O-[3-(4-ビリジリ)プロピル]オキシム]  
2'-O-アセチル-3'-N-デメチル-5-O-  
デソサニル-3'-N-エチルエリスロノライドA  
9-[O-[3-(4-ビリジリ)プロピル]オキシム]  
0.50g, 1-エチル-3-(3-ジメチルアミノプロピル)カルボジミド塩酸塩0.38g, 4-  
クロロフェニル酢酸0.33g及び4-ジメチルアミノ  
ピリジン0.10gのテトラヒドロフラン5ml混合液を、  
室温で4時間攪拌した。反応液をデカントし、不溶性  
物質にテトラヒドロフランを加え再度デカントした。デ  
カントした上澄液を合せ、溶媒を減圧留去した。残渣に  
炭酸水素ナトリウム水溶液を加え酢酸エチルで抽出し  
た。抽出液を水、飽和食塩水で順次洗浄、硫酸ナトリウム  
で乾燥後、溶媒を減圧留去し、黄褐色粘性物を得た。  
得られた粘性物のメタノール20ml溶液を室温で18時  
間攪拌した。反応液を減圧濃縮し、残渣をカラムクロマ  
トグラフィー(シリカゲル、酢酸エチル)で精製し、無  
色無晶形固体0.32gを得た。



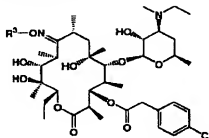
<sup>1</sup>H NMR スペクトル  $\delta$  (CDCl<sub>3</sub>) ppm: 0.82(3H, t, J=7.5Hz), 0.90(3H, d, J=6.5Hz), 1.02(3H, d, J=7.5Hz), 1.07(3H, t, J=7Hz), 1.10-1.72(20H, m), 1.81(1H, s), 1.87-2.03(3H, m), 2.19-2.30(1H, m), 2.23(3H, s), 2.32-2.43(2H, m), 2.54-2.73(4H, m), 2.78-2.88(1H, m), 2.99-3.08(1H, m), 3.10(1H, s), 3.17(1H, dd, J=10.7, 5Hz), 3.44(1H, d, J=5Hz), 3.48(1H, brs), 3.62(1H, d, J=15.5Hz), 3.58-3.74(1H, m), 3.68(1H, d, J=15.5Hz), 3.72(1H, s), 3.93(1H, d, J=7.5Hz), 4.06(2

H, t, J=6.5Hz), 4.37(1H, s), 5.16(1H, d, J=11Hz), 5.20(1H, dd, J=11.5, 2Hz), 7.13(2H, d, J=6Hz), 7.18-7.35(4H, m), 8.51(2H, d, J=6Hz)

【0112】実施例1と同様にして、実施例2～実施例35の化合物を得た。

【0113】

【表52】



実施例	R <sup>3</sup>	性状及び物性
2	Me	無色無晶形固体 NMR スペクトル $\delta$ (CDCl <sub>3</sub> ) ppm: 0.82(3H, t, J=7.5Hz), 0.89(3H, d, J=6.5Hz), 1.01(3H, d, J=6.5Hz), 1.04-1.67(20H, m), 1.07(3H, t, J=7Hz), 1.77(1H, s), 1.88-1.98(1H, m), 2.17-2.30(1H, m), 2.22(3H, s), 2.32-2.43(2H, m), 2.53-2.71(2H, m), 2.76-2.86(1H, m), 3.00-3.09(1H, m), 3.13(1H, s), 3.17(1H, dd, J=10.5, 7.5Hz), 3.44(1H, d, J=4.5Hz), 3.47(1H, brs), 3.58-3.72(1H, m), 3.62(1H, d, J=15.5Hz), 3.68(1H, d, J=15.5Hz), 3.71(1H, s), 3.83(3H, s), 3.93(1H, d, J=7.5Hz), 4.44(1H, s), 5.16(1H, d, J=11Hz), 5.21(1H, dd, J=11.5, 2Hz), 7.21-7.35(4H, m)
3	Et	無色無晶形固体 NMR スペクトル $\delta$ (CDCl <sub>3</sub> ) ppm: 0.82(3H, t, J=7.5Hz), 0.89(3H, d, J=6.5Hz), 0.98-1.70(23H, m), 1.01(3H, d, J=6.5Hz), 1.07(3H, t, J=7Hz), 1.84(1H, s), 1.88-1.98(1H, m), 2.19-2.43(3H, m), 2.22(3H, s), 2.52-2.72(2H, m), 2.76-2.88(1H, m), 2.99-3.10(1H, m), 3.13(1H, s), 3.17(1H, dd, J=10.7, 7Hz), 3.37-3.52(1H, m), 3.45(1H, d, J=4.5Hz), 3.57-3.73(1H, m), 3.62(1H, d, J=15.5Hz), 3.68(1H, d, J=15.5Hz), 3.71(1H, s), 3.93(1H, d, J=7.5Hz), 4.05-4.10(2H, m), 4.48(1H, s), 5.16(1H, d, J=11Hz), 5.21(1H, dd, J=11.2Hz), 7.20-7.35(4H, m)
4	n-Pr	無色無晶形固体 NMR スペクトル $\delta$ (CDCl <sub>3</sub> ) ppm: 0.81(3H, t, J=7.5Hz), 0.89(3H, d, J=6.5Hz), 0.94(3H, t, J=7.5Hz), 0.97-1.72(28H, m), 1.83(1H, s), 1.88-1.99(1H, m), 2.18-2.43(3H, m), 2.22(3H, s), 2.54-2.70(2H, m), 2.77-2.86(1H, m), 3.00-3.09(1H, m), 3.13(1H, s), 3.17(1H, dd, J=10.7, 5Hz), 3.44(1H, d, J=4.5Hz), 3.47(1H, brs), 3.59-3.74(1H, m), 3.62(1H, d, J=15.5Hz), 3.68(1H, d, J=15.5Hz), 3.71(1H, s), 3.80-4.04(2H, m), 3.93(1H, d, J=6.5Hz), 4.49(1H, s), 5.16(1H, d, J=10.5Hz), 5.21(1H, dd, J=11.5, 2Hz), 7.20-7.35(4H, m)



【0114】

【表53】

実施例	R <sup>3</sup>	性状及び物性
5	i-Pr	<p>無色無晶形固体</p> <p>NMR スペクトル <math>\delta</math> (CDCl<sub>3</sub>)ppm:0.81(3H,t,J=7.5Hz),0.89(3H,d,J=6.5Hz),0.96-1.70(26H,m),1.01(3H,d,J=6.5Hz),1.07(3H,t,J=7.5Hz),1.88-1.98(1H,m),1.90(1H,s),2.19-2.42(3H,m),2.22(3H,s),2.55-2.70(2H,m),2.75-2.85(1H,m),3.00-3.09(1H,m),3.13(1H,s),3.17(1H,dd,J=10.5,7.5Hz),3.44(1H,brs),3.45(1H,d,J=4.5Hz),3.60-3.70(1H,m),3.62(1H,d,J=15Hz),3.68(1H,d,J=15Hz),3.70(1H,s),3.94(1H,d,J=6.5Hz),4.22-4.32(1H,m),4.54(1H,s),5.16(1H,d,J=11Hz),5.19-5.24(1H,m),7.20-7.30(4H,m)</p>
6	n-Bu	<p>無色無晶形固体</p> <p>NMR スペクトル <math>\delta</math> (CDCl<sub>3</sub>)ppm:0.77-1.75(29H,m),0.81(3H,t,J=7.5Hz),0.89(3H,d,J=6.5Hz),0.94(3H,t,J=7.5Hz),1.01(3H,d,J=6.5Hz),1.07(3H,t,J=7Hz),1.83(1H,s),1.87-1.98(1H,m),2.18-2.30(1H,m),2.22(3H,s),2.32-2.43(2H,m),2.52-2.70(2H,m),2.77-2.90(1H,m),3.00-3.10(1H,m),3.13(1H,s),3.17(1H,dd,J=10.5,7.5Hz),3.44(1H,d,J=5Hz),3.60-3.75(1H,m),3.62(1H,d,J=14.5Hz),3.68(1H,d,J=14.5Hz),3.70(1H,s),3.93(1H,d,J=7.5Hz),4.02(2H,t,J=6.5Hz),4.48(1H,s),5.16(1H,d,J=11Hz),5.21(1H,dd,J=11.5,2Hz)</p>
7	i-Bu	<p>無色無晶形固体</p> <p>NMR スペクトル <math>\delta</math> (CDCl<sub>3</sub>)ppm:0.82(3H,t,J=7.5Hz),0.89(3H,d,J=6.5Hz),0.93(6H,d,J=6Hz),0.98-1.70(20H,m),1.02(3H,d,J=6.5Hz),1.07(3H,t,J=7Hz),1.82(1H,s),1.88-2.00(2H,m),2.18-2.45(3H,m),2.23(3H,s),2.52-2.71(2H,m),2.76-2.88(1H,m),2.99-3.10(1H,m),3.13(1H,s),3.17(1H,dd,J=10.7,5Hz),3.44(1H,d,J=4.5Hz),3.46(1H,brs),3.59-3.88(3H,m),3.62(1H,d,J=15.5Hz),3.68(1H,d,J=15.5Hz),3.70(1H,s),3.94(1H,d,J=7.5Hz),4.48(1H,s),5.15(1H,d,J=10.5Hz),5.21(1H,dd,J=11.2Hz),7.20-7.38(4H,m)</p>
8	sec-Bu	<p>無色無晶形固体</p> <p>NMR スペクトル <math>\delta</math> (CDCl<sub>3</sub>)ppm:0.81(3H,t,J=7.5Hz),0.85-1.70(28H,m),0.89(3H,d,J=6.5Hz),1.00(3H,d,J=7.5Hz),1.07(3H,t,J=7Hz),1.88,1.91(total 1H,each s),1.88-1.97(1H,m),2.19-2.42(3H,m),2.22(3H,s),2.54-2.70(2H,m),2.77-2.83(1H,m),3.00-3.10(1H,m),3.14,3.14(total 1H,each s),3.17(1H,dd,J=10.5,7.5Hz),3.44(1H,brs),3.45(1H,d,J=4.5Hz),3.60-3.72(1H,m),3.62(1H,d,J=15.5Hz),3.68(1H,d,J=15.5Hz),3.70(1H,s),3.94(1H,d,J=7.5Hz),4.02-4.14(1H,m),4.53,4.55(total 1H,each s),5.16(1H,d,J=11Hz),5.21(1H,dd,J=11.2Hz),7.20-7.30(4H,m)</p>



{0115}

{表54}

実施例	R <sup>3</sup>	性状及び物性
9	i-Pent	無色無晶形固体 NMR スペクトル $\delta$ (CDCl <sub>3</sub> )ppm:0.82(3H,t,J=7.5Hz),0.89(3H,d,J=6.5Hz),0.92(6H,d,J=6.5Hz),1.01(3H,d,J=7.5Hz),1.07(3H,t,J=7Hz),1.10-1.72(23H,m),1.83(1H,s),1.88-1.98(1H,m),2.19-2.42(3H,m),2.23(3H,s),2.55-2.67(2H,m),2.77-2.84(1H,m),3.00-3.09(1H,m),3.13(1H,s),3.17(1H,dd,J=10.5,7.5Hz),3.44(1H,brs),3.44(1H,d,J=4.5Hz),3.60-3.71(1H,m),3.62(1H,d,J=15Hz),3.68(1H,d,J=15Hz),3.70(1H,s),3.93(1H,d,J=7.5Hz),4.05(2H,t,J=6.5Hz),4.48(1H,s),5.16(1H,d,J=11Hz),5.21(1H,dd,J=11.2Hz),7.20-7.30(4H,m)
10		無色無晶形固体 NMR スペクトル $\delta$ (CDCl <sub>3</sub> )ppm:0.75-1.70(33H,m),0.81(3H,t,J=7.5Hz),1.00(3H,d,J=6.5Hz),1.07(3H,t,J=7.5Hz),1.85(1H,s),1.88-1.98(1H,m),2.19-2.42(3H,m),2.22(3H,s),2.51-2.70(2H,m),2.76-2.85(1H,m),3.00-3.08(1H,m),3.14(1H,s),3.17(1H,dd,J=10.5,7.5Hz),3.45(1H,d,J=4.5Hz),3.47(1H,brs),3.62(1H,d,J=15.5Hz),3.65-3.73(1H,m),3.68(1H,d,J=15.5Hz),3.70(1H,s),3.88-3.95(1H,m),3.94(1H,d,J=7.5Hz),4.53(1H,s),5.16(1H,d,J=11Hz),5.20(1H,dd,J=11.2Hz),7.20-7.30(4H,m)
11	n-Hex	無色無晶形固体 NMR スペクトル $\delta$ (CDCl <sub>3</sub> )ppm:0.81(3H,t,J=7.5Hz),0.89(3H,d,J=6.5Hz),0.90(3H,t,J=7Hz),1.01(3H,d,J=7.5Hz),1.07(3H,t,J=7Hz),1.10-1.68(28H,m),1.84(1H,s),1.87-1.97(1H,m),2.19-2.30(1H,m),2.22(3H,s),2.30-2.41(2H,m),2.53-2.69(2H,m),2.76-2.85(1H,m),3.00-3.08(1H,m),3.13(1H,s),3.17(1H,dd,J=10.7,7.5Hz),3.44(1H,d,J=4.5Hz),3.47(1H,brs),3.60-3.71(1H,m),3.62(1H,d,J=15.5Hz),3.68(1H,d,J=15.5Hz),3.70(1H,s),3.93(1H,d,J=7.5Hz),4.01(2H,t,J=6.5Hz),4.49(1H,s),5.15(1H,d,J=11Hz),5.21(1H,dd,J=11.5,2Hz),7.19-7.30(4H,m)
12		無色無晶形固体 NMR スペクトル $\delta$ (CDCl <sub>3</sub> )ppm:0.82(3H,t,J=7.5Hz),0.85-0.93(9H,m),0.95-1.70(25H,m),1.01(3H,d,J=6.5Hz),1.07(3H,t,J=7Hz),1.80(1H,s),1.88-1.98(1H,m),2.20-2.42(3H,m),2.22(3H,s),2.54-2.67(2H,m),2.77-2.85(1H,m),3.00-3.09(1H,m),3.14(1H,s),3.17(1H,dd,J=10.7,7.5Hz),3.44(1H,d,J=4.5Hz),3.46(1H,brs),3.59-3.71(1H,m),3.62(1H,d,J=15.5Hz),3.68(1H,d,J=15.5Hz),3.70(1H,s),3.85-4.00(3H,m),4.49(1H,s),5.16(1H,d,J=11Hz),5.21(1H,d,J=11.2Hz),7.20-7.30(4H,m)





【 0116 】

【 表 55 】

実施例	R <sup>3</sup>	性状及び物性
13	n-Oct	<p>無色無晶形固体</p> <p>NMR スペクトル <math>\delta</math> (CDCl<sub>3</sub>)ppm: 0.82(3H,t,J=7.5Hz), 0.85-1.70(39H,m), 1.01(3H,d,J=6.5Hz), 1.07(3H,t,J=7Hz), 1.83(1H,s), 1.87-1.98(1H,m), 2.18-2.30(1H,m), 2.22(3H,s), 2.30-2.42(2H,m), 2.52-2.68(2H,m), 2.76-2.85(1H,m), 3.00-3.08(1H,m), 3.13(1H,s), 3.17(1H,dd,J=10.75Hz), 3.44(1H,d,J=4.5Hz), 3.58-3.71(1H,m), 3.62(1H,d,J=14.5Hz), 3.68(1H,d,J=14.5Hz), 3.70(1H,s), 3.93(1H,d,J=7.5Hz), 3.97-4.05(2H,m), 4.48(1H,s), 5.16(1H,d,J=11Hz), 5.21(1H,dd,J=11.5,2Hz), 7.20-7.30(4H,m)</p>
14	n-Dodec	<p>無色無晶形固体</p> <p>NMR スペクトル <math>\delta</math> (CDCl<sub>3</sub>)ppm: 0.82(3H,t,J=7.5Hz), 0.88(3H,d,J=7Hz), 0.89(3H,d,J=6.5Hz), 1.01(3H,d,J=7.5Hz), 1.05-1.70(40H,m), 1.07(3H,t,J=7Hz), 1.84(1H,s), 1.87-1.98(1H,m), 2.22(3H,s), 2.22-2.29(1H,m), 2.30-2.42(2H,m), 2.52-2.70(2H,m), 2.76-2.85(1H,m), 3.00-3.09(1H,m), 3.13(1H,s), 3.17(1H,dd,J=10.75Hz), 3.44(1H,d,J=4.5Hz), 3.46(1H,brs), 3.60-3.71(1H,m), 3.62(1H,d,J=14.5Hz), 3.68(1H,d,J=14.5Hz), 3.70(1H,s), 3.93(1H,d,J=7.5Hz), 4.00(2H,td,J=6.5, 2Hz), 4.49(1H,s), 5.16(1H,d,J=11Hz), 5.21(1H,dd,J=11.5,2Hz), 7.18-7.30(4H,m)</p>
15	Boc- 	<p>無色無晶形固体</p> <p>NMR スペクトル <math>\delta</math> (CDCl<sub>3</sub>)ppm: 0.82(3H,t,J=7.5Hz), 0.89(3H,d,J=6.5Hz), 0.95-2.00(25H,m), 1.02(3H,d,J=6.5Hz), 1.07(3H,t,J=7Hz), 1.47(9H,s), 1.77(1H,s), 2.18-2.30(1H,m), 2.22(3H,s), 2.32-2.43(2H,m), 2.54-2.70(2H,m), 2.76-2.86(1H,m), 3.00-3.27(3H,m), 3.10(1H,s), 3.17(1H,dd,J=10.7Hz), 3.44(1H,d,J=4.5Hz), 3.48(1H,brs), 3.58-3.80(3H,m), 3.62(1H,d,J=15.5Hz), 3.68(1H,d,J=15.5Hz), 3.71(1H,s), 3.92(1H,d,J=7.5Hz), 4.13-4.25(1H,m), 4.38(1H,s), 5.15(1H,d,J=11Hz), 5.20(1H,dd,J=11.2Hz), 7.20-7.35(4H,m)</p>
16	NH- 	<p>無色固体</p> <p>NMR スペクトル <math>\delta</math> (CDCl<sub>3</sub>)ppm: 0.81(3H,t,J=7.5Hz), 0.89(3H,d,J=6.5Hz), 0.97-2.00(26H,m), 1.02(3H,d,J=6.5Hz), 1.07(3H,t,J=7Hz), 1.88(1H,s), 2.17-2.43(3H,m), 2.22(3H,s), 2.53-2.73(4H,m), 2.77-2.86(1H,m), 2.99-3.20(3H,m), 3.12(1H,brs), 3.17(1H,dd,J=10.7Hz), 3.44(1H,d,J=4.5Hz), 3.47(1H,brs), 3.58-3.78(1H,m), 3.62(1H,d,J=15.5Hz), 3.68(1H,d,J=15.5Hz), 3.71(1H,s), 3.93(1H,d,J=7.5Hz), 4.07-4.18(1H,m), 4.47(1H,s), 5.15(1H,d,J=11Hz), 5.20(1H,dd,J=11.5,2Hz), 7.20-7.35(4H,m)</p>





[0117]

[表56]

実施例	R <sup>2</sup>	性状及び物性
17		無色無晶形固体 NMR スペクトル $\delta$ (CDCl <sub>3</sub> )ppm:0.82(3H,t,J=7.5Hz),0.89(3H,d,J=6.5Hz),0.96-2.10(27H,m),1.01(3H,d,J=7.5Hz),1.07(3H,t,J=7Hz),1.82(1H,s),2.18-2.30(1H,m),2.22(3H,s),2.32-2.43(2H,m),2.52-2.70(3H,m),2.76-2.87(1H,m),2.99-3.10(1H,m),3.13(1H,s),3.17(1H,dd,J=10.75Hz),3.44(1H,d,J=5Hz),3.45(1H,bre),3.57-3.73(1H,m),3.62(1H,d,J=15.5Hz),3.68(1H,d,J=15.5Hz),3.70(1H,s),3.93(1H,d,J=7.5Hz),4.00(2H,t,J=6.5Hz),4.46(1H,s),5.16(1H,d,J=10.5Hz),5.21(1H,dd,J=11.5,2Hz),7.20-7.32(4H,m)
18		無色無晶形固体 NMR スペクトル $\delta$ (CDCl <sub>3</sub> )ppm:0.81(3H,t,J=7.5Hz),0.89(3H,d,J=6.5Hz),0.96-1.80(28H,m),1.01(3H,d,J=6.5Hz),1.07(3H,t,J=7Hz),1.85(1H,s),1.88-1.98(1H,m),2.15-2.43(4H,m),2.22(3H,s),2.53-2.71(2H,m),2.76-2.86(1H,m),3.00-3.10(1H,m),3.13(1H,s),3.17(1H,dd,J=10.75Hz),3.44(1H,d,J=4.5Hz),3.47(1H,bre),3.56-3.73(1H,m),3.62(1H,d,J=15Hz),3.68(1H,d,J=15Hz),3.70(1H,s),3.85-3.99(3H,m),4.49(1H,s),5.16(1H,d,J=11Hz),5.21(1H,dd,J=11.5,2Hz),7.20-7.35(4H,m)
19		無色無晶形固体 NMR スペクトル $\delta$ (CDCl <sub>3</sub> )ppm:0.82(3H,t,J=7.5Hz),0.89(3H,d,J=6.5Hz),0.91-1.80(31H,m),1.01(3H,d,J=6.5Hz),1.07(3H,t,J=7Hz),1.84(1H,s),1.88-1.98(1H,m),2.19-2.42(3H,m),2.22(3H,s),2.54-2.70(2H,m),2.76-2.85(1H,m),3.00-3.09(1H,m),3.13(1H,s),3.17(1H,dd,J=10.7Hz),3.44(1H,d,J=4.5Hz),3.46(1H,bre),3.60-3.71(1H,m),3.62(1H,d,J=15Hz),3.68(1H,d,J=15Hz),3.69(1H,s),3.79-3.90(2H,m),3.94(1H,d,J=7.5Hz),4.49(1H,s),5.16(1H,d,J=11Hz),5.21(1H,dd,J=11.2Hz),7.20-7.30(4H,m)
20		無色無晶形固体 NMR スペクトル $\delta$ (CDCl <sub>3</sub> )ppm:0.75-1.78(33H,m),0.81(3H,t,J=7.5Hz),0.89(3H,d,J=6.5Hz),1.01(3H,d,J=7.5Hz),1.07(3H,t,J=7Hz),1.82(1H,s),1.85-2.00(1H,m),2.20-2.42(3H,m),2.22(3H,s),2.57-2.73(2H,m),2.79-2.88(1H,m),3.00-3.10(1H,m),3.13(1H,s),3.17(1H,dd,J=10.75Hz),3.44(1H,d,J=4.5Hz),3.47(1H,bre),3.60-3.75(3H,m),3.69(1H,s),3.93(1H,d,J=7.5Hz),4.05(2H,t,J=7Hz),4.47(1H,s),5.16(1H,d,J=11Hz),5.21(1H,dd,J=11.2Hz),7.20-7.32(4H,m)


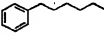


[0118]

[表57]

実施例	R <sup>1</sup>	性状及び物性
21		無色無晶形固体 NMR スペクトル $\delta$ (CDCl <sub>3</sub> )ppm:0.77-1.80(35H,m),0.82(3H,t,J=7.5Hz),0.89(3H,d,J=6.5Hz),1.01(3H,d,J=6.5Hz),1.07(3H,t,J=7Hz),1.85(1H,s),1.88-2.00(1H,m),2.18-2.44(3H,m),2.22(3H,s),2.54-2.70(2H,m),2.77-2.87(1H,m),3.00-3.10(1H,m),3.13(1H,s),3.17(1H,dd,J=10.5,7.5Hz),3.40-3.52(1H,m),3.44(1H,d,J=4.5Hz),3.58-3.73(1H,m),3.62(1H,d,J=15Hz),3.68(1H,d,J=15Hz),3.70(1H,s),3.92-4.05(2H,m),3.94(1H,d,J=7.5Hz),4.49(1H,s),5.16(1H,d,J=11Hz),5.21(1H,dd,J=11.2Hz),7.20-7.35(4H,m)
22		無色無晶形固体 NMR スペクトル $\delta$ (CDCl <sub>3</sub> )ppm:0.82(3H,t,J=7.5Hz),0.90(3H,d,J=6.5Hz),0.98(3H,d,J=7.5Hz),1.06(3H,t,J=7Hz),1.10-1.70(20H,m),1.53(1H,s),1.86-1.99(1H,m),2.18-2.42(3H,m),2.22(3H,s),2.53-2.70(2H,m),2.77-2.86(1H,m),2.97-3.10(1H,m),3.13(1H,s),3.15(1H,dd,J=10.5,7.5Hz),3.39(1H,d,J=4.5Hz),3.47(1H,br s),3.58-3.75(1H,m),3.62(1H,d,J=15Hz),3.68(1H,d,J=15Hz),3.72(1H,s),3.91(1H,d,J=7.5Hz),4.39(1H,s),5.03(1H,d,J=11.5Hz),5.07(1H,d,J=11.5Hz),5.13(1H,d,J=11Hz),5.21(1H,dd,J=11.2Hz),7.20-7.40(9H,m)
23		無色無晶形固体 NMR スペクトル $\delta$ (CDCl <sub>3</sub> )ppm:0.82(3H,t,J=7.5Hz),0.90(3H,d,J=6.5Hz),0.97(3H,d,J=7.5Hz),1.02-1.67(21H,m),1.06(3H,t,J=7Hz),1.88-2.00(1H,m),2.15-2.28(1H,m),2.22(3H,s),2.30-2.42(2H,m),2.53-2.68(2H,m),2.75-2.86(1H,m),2.95(2H,t,J=6.5Hz),2.99-3.09(1H,m),3.10-3.20(1H,m),3.14(1H,s),3.35(1H,d,J=4.5Hz),3.46(1H,br s),3.51-3.63(1H,m),3.62(1H,d,J=15Hz),3.68(1H,d,J=15Hz),3.72(1H,s),3.91(1H,d,J=7.5Hz),4.20-4.32(2H,m),4.47(1H,s),5.14(1H,d,J=11Hz),5.22(1H,dd,J=11.2Hz),7.15-7.40(9H,m)
24		無色無晶形固体 NMR スペクトル $\delta$ (CDCl <sub>3</sub> )ppm:0.82(3H,t,J=7.5Hz),0.89(3H,d,J=6.5Hz),1.02(3H,d,J=6.5Hz),1.07(3H,t,J=7Hz),0.98-1.70(21H,m),1.84(1H,s),1.87-2.00(3H,m),2.20-2.45(3H,m),2.22(3H,s),2.53-2.73(4H,m),2.77-2.87(1H,m),3.00-3.10(1H,m),3.12(1H,s),3.17(1H,dd,J=10.7,7.5Hz),3.44(1H,d,J=4.5Hz),3.60-3.73(1H,m),3.62(1H,d,J=15Hz),3.69(1H,d,J=15Hz),3.71(1H,s),3.93(1H,d,J=7.5Hz),4.05(2H,t,J=6.5Hz),4.44(1H,s),5.16(1H,d,J=11Hz),5.21(1H,dd,J=11.5,2Hz),7.16-7.21(3H,m),7.25-7.32(6H,m)




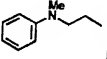
【0119】

【表58】

実施例	R <sup>3</sup>	性状及び物性
25		無色無晶形固体 NMR スペクトル $\delta$ (CDCl <sub>3</sub> )ppm:0.82(3H,t,J=7.5Hz),0.89(3H,d,J=6.5Hz),0.95-1.75(24H,m),1.00(3H,d,J=7.5Hz),1.07(3H,t,J=7Hz),1.78(1H,s),1.87-1.99(1H,m),2.18-2.45(3H,m),2.22(3H,s),2.54-2.70(4H,m),2.76-2.86(1H,m),3.00-3.10(1H,m),3.13(1H,s),3.17(1H,dd,J=10.75Hz),3.47(1H,brs),3.44(1H,d,J=5Hz),3.58-3.73(1H,m),3.62(1H,d,J=15.5Hz),3.68(1H,d,J=15.5Hz),3.71(1H,s),3.93(1H,d,J=7.5Hz),3.97-4.08(2H,m),4.46(1H,s),5.16(1H,d,J=11Hz),5.21(1H,dd,J=11.2Hz),7.10-7.35(9H,m)
26		無色無晶形固体 NMR スペクトル $\delta$ (CDCl <sub>3</sub> )ppm:0.82(3H,t,J=7.5Hz),0.89(3H,d,J=6.5Hz),0.99(3H,d,J=6.5Hz),1.07(3H,t,J=7Hz),1.10-1.70(26H,m),1.79(1H,s),1.88-1.99(1H,m),2.18-2.44(3H,m),2.22(3H,s),2.53-2.70(4H,m),2.77-2.88(1H,m),3.00-3.10(1H,m),3.12(1H,s),3.17(1H,dd,J=10.7Hz),3.40-3.52(1H,m),3.44(1H,d,J=4.5Hz),3.58-3.73(1H,m),3.62(1H,d,J=15.5Hz),3.68(1H,d,J=15.5Hz),3.70(1H,s),3.94(1H,d,J=6.5Hz),4.01(2H,t,J=6.5Hz),4.46(1H,s),5.16(1H,d,J=11.5Hz),5.21(1H,dd,J=11.25Hz),7.10-7.35(9H,m)
27		無色無晶形固体 NMR スペクトル $\delta$ (CDCl <sub>3</sub> )ppm:0.82(3H,t,J=7.5Hz),0.88(3H,d,J=6.5Hz),0.99(3H,d,J=6.5Hz),1.02-1.65(20H,m),1.06(3H,t,J=7.5Hz),1.88-1.98(1H,m),2.00(1H,s),2.21(3H,s),2.22-2.40(3H,m),2.52-2.61(1H,m),2.62-2.70(1H,m),2.75-2.85(1H,m),3.00-3.08(1H,m),3.11(1H,s),3.15(1H,dd,J=10.5,7.5Hz),3.38(1H,d,J=4.5Hz),3.45(1H,brs),3.61(1H,d,J=15.5Hz),3.66-3.75(1H,m),3.67(1H,d,J=15.5Hz),3.79(1H,s),3.92(1H,d,J=7.5Hz),4.15(2H,t,J=4.5Hz),4.35-4.40(2H,m),4.37(1H,s),5.13(1H,d,J=11Hz),5.21(1H,dd,J=11.2Hz),6.90-7.00(3H,m),7.23-7.32(6H,m)
28		無色無晶形固体 NMR スペクトル $\delta$ (CDCl <sub>3</sub> )ppm:0.82(3H,t,J=7.5Hz),0.89(3H,d,J=6.5Hz),0.95-1.70(20H,m),1.00(3H,d,J=7.5Hz),1.07(3H,t,J=7Hz),1.75(1H,s),1.87-1.99(1H,m),2.06-2.30(3H,m),2.20(3H,s),2.31-2.43(2H,m),2.55-2.72(2H,m),2.77-2.88(1H,m),2.99-3.10(1H,m),2.99-3.10(1H,m),3.13(1H,s),3.16(1H,dd,J=10.75Hz),3.42(1H,d,J=4.5Hz),3.47(1H,brs),3.58-3.77(1H,m),3.62(1H,d,J=15.5Hz),3.68(1H,d,J=15.5Hz),3.73(1H,s),3.92(1H,d,J=7.5Hz),4.05(2H,t,J=4.5Hz),4.15-4.28(2H,m),4.42(1H,s),5.15(1H,d,J=11Hz),5.21(1H,dd,J=11.5,2Hz),6.87-6.97(3H,m),7.23-7.34(6H,m)

【0120】

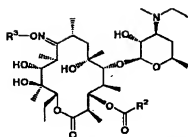
【表59】

実施例	R <sup>3</sup>	性状及び物性
29		無色無晶形固体 NMR スペクトル $\delta$ (CDCl <sub>3</sub> )ppm:0.82(3H,t,J=7.5Hz),0.89(3H,d,J=6.5Hz),0.95-1.90(25H,m),1.01(3H,d,J=6.5Hz),1.07(3H,t,J=7Hz),1.90-1.98(1H,m),2.19-2.30(1H,m),2.22(3H,s),2.30-2.41(2H,m),2.52-2.70(2H,m),2.77-2.85(1H,m),2.98-3.07(1H,m),3.12(1H,s),3.17(1H,dd,J=10.7,5Hz),3.44(1H,d,J=5Hz),3.47(1H,brs),3.60-3.71(1H,m),3.62(1H,d,J=15.5Hz),3.68(1H,d,J=15.5Hz),3.72(1H,s),3.93(1H,d,J=6.5Hz),4.00(2H,t,J=6Hz),4.10(2H,t,J=6Hz),4.44(1H,s),5.16(1H,d,J=11Hz),5.21(1H,dd,J=11.2Hz),6.86-6.95(3H,m),7.20-7.31(6H,m)
30		無色無晶形固体 NMR スペクトル $\delta$ (CDCl <sub>3</sub> )ppm:0.82(3H,t,J=7.5Hz),0.90(3H,d,J=6.5Hz),1.01(3H,d,J=6.5Hz),1.04-1.65(20H,m),1.07(3H,t,J=7Hz),1.88-1.98(1H,m),2.04(1H,s),2.21(3H,s),2.22-2.42(3H,m),2.52-2.71(2H,m),2.77-2.85(1H,m),3.00-3.19(4H,m),3.11(1H,s),3.43(1H,d,J=4.5Hz),3.47(1H,brs),3.62(1H,d,J=15.5Hz),3.64-3.71(1H,m),3.67(1H,d,J=15.5Hz),3.76(1H,s),3.93(1H,d,J=7.5Hz),4.09-4.23(2H,m),4.28(1H,s),5.17(1H,d,J=11Hz),5.21(1H,d,J=11.2Hz),7.18-7.42(9H,m)
31		無色無晶形固体 NMR スペクトル $\delta$ (CDCl <sub>3</sub> )ppm:0.82(3H,t,J=7.5Hz),0.90(3H,d,J=6.5Hz),0.99(3H,d,J=6.5Hz),1.03-1.70(21H,m),1.06(3H,t,J=7.5Hz),1.88-1.97(1H,m),2.18-2.27(1H,m),2.22(3H,s),2.30-2.40(2H,m),2.52-2.61(1H,m),2.61-2.70(1H,m),2.76-2.84(1H,m),2.99-3.07(1H,m),3.10-3.20(3H,m),3.13(1H,s),3.37(1H,d,J=5Hz),3.46(1H,brs),3.59-3.70(1H,m),3.62(1H,d,J=15Hz),3.67(1H,d,J=15Hz),3.73(1H,s),3.91(1H,d,J=6.5Hz),4.27(2H,t,J=6.5Hz),4.41(1H,s),5.14(1H,d,J=11Hz),5.21(1H,dd,J=11.2,5Hz),6.84(1H,d,J=3.5Hz),6.95(1H,dd,J=5.3,5Hz),7.16(1H,dd,J=5.1Hz),7.23-7.31(4H,m)
32		無色無晶形固体 NMR スペクトル $\delta$ (CDCl <sub>3</sub> )ppm:0.82(3H,t,J=7.5Hz),0.89(3H,d,J=6.5Hz),0.95(3H,d,J=6.5Hz),1.06(3H,t,J=7Hz),1.03-1.60(20H,m),1.86-1.97(1H,m),1.94(1H,s),2.17-2.28(1H,m),2.22(3H,s),2.30-2.41(2H,m),2.52-2.68(2H,m),2.76-2.85(1H,m),2.94(1H,s),3.00-3.08(1H,m),3.11(1H,s),3.15(1H,dd,J=10.7Hz),3.40(1H,d,J=5Hz),3.46(1H,brs),3.47-3.63(3H,m),3.62(1H,d,J=15Hz),3.67(1H,d,J=15Hz),3.74(1H,s),3.92(1H,d,J=7.5Hz),4.21(2H,t,J=5.5Hz),4.39(1H,s),5.16(1H,d,J=11Hz),5.21(1H,dd,J=11.2,5Hz),6.72(1H,t,J=7.5Hz),6.75(2H,d,J=6.5Hz),7.20-7.30(6H,m)

[0121]

【表60】





実施例	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	性状及び物性
33			無色無晶形固体 NMR スペクトル $\delta$ (CDCl <sub>3</sub> )ppm:0.81(3H,t,J=7.5H z),0.87(3H,d,J=6.5Hz),1.02(3H,d,J=7.5Hz),1.07(3H,t,J=7Hz),0.98-2.03(23H,m),1.82(1H,s),2.18-2.31(1H,m),2.22(3H,s),2.32-2.45(2H,m),2.54-2.74(4H,m),2.76-2.87(1H,m),3.05-3.20(1H,m),3.11(1H,s),3.17(1H,dd,J=10.5,7.5Hz),3.40-3.54(1H,m),3.48(1H,d,J=5Hz),3.60-3.75(1H,m),3.65(1H,d,J=15Hz),3.70(1H,d,J=15Hz),3.72(1H,s),3.87(1H,d,J=7.5Hz),4.06(2H,t,J=6Hz),4.38(1H,s),5.16(1H,d,J=11Hz),5.20(1H,dd,J=11,2Hz),7.13(2H,d,J=6Hz),7.22-7.37(5H,m),8.50(2H,d,J=6Hz)
34			無色無晶形固体 NMR スペクトル $\delta$ (CDCl <sub>3</sub> )ppm:0.82(3H,t,J=7.5H z),0.93-1.75(20H,m),0.96(3H,d,J=6.5Hz),1.03(3H,d,J=7.5Hz),1.08(3H,t,J=7Hz),1.80(1H,s),1.87-2.03(3H,m),2.20-2.30(1H,m),2.24(3H,s),2.33-2.43(1H,m),2.47-2.74(5H,m),2.78-2.87(1H,m),3.10(1H,s),3.20(1H,dd,J=10.7,5Hz),3.28-3.38(1H,m),3.44-3.58(1H,m),3.48(1H,d,J=4.5Hz),3.60-3.70(1H,m),3.72(1H,s),3.83(1H,d,J=16Hz),3.90(1H,d,J=16Hz),4.06(2H,t,J=6.5Hz),4.10(1H,d,J=6.5Hz),4.37(1H,s),5.19(1H,d,J=11Hz),5.20(1H,dd,J=11.5,2Hz),7.13(2H,d,J=6Hz),7.19-7.29(2H,m),7.33-7.43(2H,m),8.50(2H,d,J=6Hz)
35			淡黄色無晶形固体 NMR スペクトル $\delta$ (CDCl <sub>3</sub> )ppm:0.82(3H,t,J=7.5H z),0.93(3H,d,J=6.5Hz),1.03(3H,d,J=6.5Hz),1.07(3H,t,J=7.5Hz),1.10-1.85(21H,m),1.88-2.03(3H,m),2.20-2.31(1H,m),2.23(3H,s),2.33-2.47(2H,m),2.54-2.75(4H,m),2.78-2.90(1H,m),3.05-3.21(1H,m),3.10(1H,s),3.18(1H,dd,J=10.7,5Hz),3.46(1H,d,J=5Hz),3.49(1H,brs),3.60-3.76(1H,m),3.64(1H,d,J=15.5Hz),3.69(1H,d,J=15.5Hz),3.72(1H,s),3.94(1H,d,J=7.5Hz),4.06(2H,t,J=6.5Hz),4.37(1H,s),5.17(1H,d,J=11Hz),5.21(1H,dd,J=11,2Hz),7.13(2H,d,J=5.5Hz),7.21-7.37(4H,m),8.51(2H,d,J=5.5Hz)

## 【0122】実施例36

3-O-(4-クロロフェニル)アセチル-3'-N-デメチル-5-O-デソサミニル-3'-N-エチルエリスロノライドA 9-(O-シクロヘキシルオキシム)

3-O-(4-クロロフェニル)アセチル-3'-N-デメチル-5-O-デソサミニルエリスロノライドA 9-(O-シクロヘキシルオキシム) 0.97gのメタ

ノール10ml溶液に、室温攪拌下N,N-ジイソプロピルエチルアミン1.04ml及びヨウ化エチル0.35mlを順次加え、外温50℃にて15時間攪拌した。反応混合物にN,N-ジイソプロピルエチルアミン0.52ml及びヨウ化エチル0.18mlを加え、外温50℃にて2.5時間攪拌し、更に、反応混合物にN,N-ジイソプロピルエチルアミン0.52ml及びヨウ化エチル0.18mlを加え、外温50℃にて5時間攪拌した。反応液

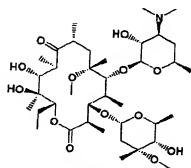
を減圧濃縮し、残渣を酢酸エチルで抽出し、水、飽和食塩水で順次洗浄、硫酸ナトリウムで乾燥後、溶媒を減圧留去した。残渣をカラムクロマトグラフィー（シリカゲル、酢酸エチル）で精製し、無色無晶形固体0.62 gを得た。

NMRスペクトル  $\delta$  (CDCl<sub>3</sub>) ppm: 0.81 (3H, t, J=7.5Hz), 0.89 (3H, d, J=6.5Hz), 0.98-1.97 (31H, m), 1.01 (3H, d, J=6.5Hz), 1.07 (3H, t, J=7Hz), 1.95 (1H, s), 2.19-2.42 (3H, m), 2.22 (3H, s), 2.53-2.69 (2H, m), 2.77-2.85 (1H, m), 3.00-3.08 (1H, m), 3.13 (1H, s), 3.17 (1H, dd, J=10.7, 7.5Hz), 3.45 (1H, d, J=4.5Hz), 3.47 (1H, brs), 3.60-3.71 (1H, m), 3.62 (1H, d, J=15.5Hz), 3.68 (1H, d, J=15.5Hz), 3.70 (1H, s), 3.93 (1H, d, J=7.5Hz), 3.96-4.05 (1H, m), 4.56 (1H, s), 5.16 (1H, d, J=11Hz), 5.21 (1H, dd, J=11, 2Hz), 7.20-7.35 (4H, m)

【0123】以下、本発明化合物の優れた効果を確認するために、ヘリコバクター・ピロリに対する抗菌スペクトルの測定を行った。尚、対照化合物としてはクラリスロマイシンを用いた。

【0124】

【化11】



対照化合物  
(クラリスロマイシン)

試験菌	実施例 1	実施例 7	実施例 19	対照 化合物
H.pylori TK1147	0.20	0.39	0.78	6.25
H.pylori TK1308-CAM-r1	0.39	0.78	3.13	12.5
H.pylori TK1308-CAM-r1 25-2	0.78	0.39	1.56	>100
H.pylori TK1308-CAM-r1 25-3	0.78	0.78	3.13	>100

【0127】

【発明の効果】本発明に係るエリスロマイシン誘導体又はその塩は、多剤耐性菌を含むヘリコバクター・ピロリ

に対して優れた抗菌力を有し、抗菌剤又は抗潰瘍剤として極めて有用である。

フロントページの続き

(72)発明者 西本 明美  
福井県勝山市猪野口37号1番地1 北陸製  
薬株式会社内

(72)発明者 成田 研  
福井県勝山市猪野口37号1番地1 北陸製  
薬株式会社内

Fターム(参考) 4C057 B802 DD01 KK13  
4C086 AA01 AA02 AA03 EA13 MA04  
NA14 ZA68 ZB35

**This Page is Inserted by IFW Indexing and Scanning  
Operations and is not part of the Official Record**

**BEST AVAILABLE IMAGES**

Defective images within this document are accurate representations of the original documents submitted by the applicant.

Defects in the images include but are not limited to the items checked:

- ☐ BLACK BORDERS
- ☒ IMAGE CUT OFF AT TOP, BOTTOM OR SIDES
- ☐ FADED TEXT OR DRAWING
- ☐ BLURRED OR ILLEGIBLE TEXT OR DRAWING
- ☐ SKEWED/SLANTED IMAGES
- ☐ COLOR OR BLACK AND WHITE PHOTOGRAPHS
- ☐ GRAY SCALE DOCUMENTS
- ☐ LINES OR MARKS ON ORIGINAL DOCUMENT
- ☐ REFERENCE(S) OR EXHIBIT(S) SUBMITTED ARE POOR QUALITY
- ☐ OTHER: \_\_\_\_\_

**IMAGES ARE BEST AVAILABLE COPY.**

**As rescanning these documents will not correct the image problems checked, please do not report these problems to the IFW Image Problem Mailbox.**

**THIS PAGE BLANK (USPTO)**